

AN 1991-103702 [15] WPIDS  
DNC C1991-044473  
TI New pantothenic acid derivs. - are ACAT inhibitors in prevention and treatment of hyperlipidaemia, arteriosclerosis, angina pectoris, myocardial infarction and thrombosis.  
DC B03 B05  
IN IKAWA, H; KOBAYASHI, N; KUSUNOKI, J; MATSUMOTO, H  
PA (FJRE) FUJI REBIO INC; (FJRE) FUJIREBIO KK; (FJRE) FUJI REBIO KK  
CYC 9  
PI EP 421441 A 19910410 (199115)\* 158p  
R: CH DE FR GB LI NL  
JP 03218340 A 19910925 (199145) <--  
JP 03218350 A 19910925 (199145)  
JP 03218366 A 19910925 (199145)  
US 5120738 A 19920609 (199226) 81p  
EP 421441 B1 19950125 (199508) EN 186p  
R: CH DE FR GB LI NL  
DE 69016335 E 19950309 (199515)  
JP 2532299 B2 19960911 (199641) 132p  
KR 9607800 B1 19960612 (199919)#  
JP 2997535 B2 20000111 (200007) 54p  
JP 2997536 B2 20000111 (200007) 30p  
ADT EP 421441 A EP 1990-119090 19901005; JP 03218340 A JP 1990-265090 19901004; JP 03218350 A JP 1990-293523 19901101; JP 03218366 A JP 1990-293524 19901101; US 5120738 A US 1990-598900 19901005; EP 421441 B1 EP 1990-119090 19901005; DE 69016335 E DE 1990-616335 19901005; EP 1990-119090 19901005; JP 2532299 B2 JP 1990-265090 19901004; KR 9607800 B1 KR 1991-2917 19910222; JP 2997535 B2 JP 1990-293523 19901101; JP 2997536 B2 JP 1990-293524 19901101  
FDT DE 69016335 E Based on EP 421441; JP 2532299 B2 Previous Publ. JP 03218340; JP 2997535 B2 Previous Publ. JP 03218350; JP 2997536 B2 Previous Publ. JP 03218366  
PRAI JP 1989-286759 19891102; JP 1989-261610 19891006; JP 1989-286758 19891102; JP 1990-265090 19901004; JP 1990-293524 19901101; JP 1990-293523 19901101; KR 1991-2917 19910222  
AN 1991-103702 [15] WPIDS  
AB EP 421441 A UPAB: 19930928  
Pantothenic acid derivs. of formula (I) are new; R1, R2 = H or an OH protecting group. R3 = opt. unsatd. or cyclic 5-25C aliphatic hydrocarbon (II) (which is opt. substd. by an aromatic gp. or -NR4R5, where R4 is the same as (II) and R5 is H or an opt. unsatd. or cyclic hydrocarbon which may be substd. by an aromatic gp.; Q = (a)-X1-A-y1-, where A is an opt. unsatd. or cyclic 2-16C aliphatic hydrocarbon (which may be substd. by an aromatic gp. or an aromatic hydrocarbon or heterocyclic and one of X1 and Y1 is N(R6)- and the other is -O-, -S- or N(R7)-, where R6 and R7 are H or lower alkyl; (b)-X2-(CH2)q-Y2-, where one of X2 and Y2 is a 4-7 membered

N-contg. heterocycle, and the other is -O-, -S- or -N(R6)-, and q = 0, 1 or 2, or (c) piperazinyl or tetrahydro-1, 4-diazepinyl. n = 1,2,3 or 4.

The daily oral or rectal dose is 2-500 mg/Kg, taken 1-4 times daily.

USE/ADVANTAGE - (I) are good acyl CoA-cholesterol-acyltransferase inhibitors in the prevention and treatment of hyperlipidaemia, arteriosclerosis, angina pectoris, myocardial infarction and thrombosis.

0/0

ABEQ US 5120738 A UPAB: 19930928

Pantothenic acid derivs. of formula (I) are new. R1 and R2 are each H or OH-protecting gp. or together form ylidene gp.; R3 is (1) (un)satd. 5-25C monovalent aliphatic hydrocarbon (less than 10C if cyclic) opt. substd. by 6-10C aromatic hydrocarbon or 5-10 ring C aromatic heterocyclic with 1-4 O, S or N atoms, substits. opt. substd. or (2) R3 is -NR4R5 where R4 is as (1) above and R5 is H, or as (1) above; Q is -X1-A-Y1 where A is (un)satd. divalent 2-16C aliphatic hydrocarbon (or if cyclic up to 7C) opt. substd. by 6-10C aromatic gp. or heteroaryl, viz. furyl, thienyl, pyridyl or indolyl or is 6-10C divalent aromatic or 5-10C divalent heterocyclic with 1 or 2 N, O or S atoms; one of X1 and Y1 is =NR6 and the other is O, S or =NR7 with R6 and R7 each H or 1-6C alkyl; Q is -X2(CH2)l-Y2- where one of X2 and Y2 is (a) and the other is O, S or N where (a) is 4 to 7-membered divalent N-contg. aromatic heterocyclic; or Q is (b) with m is 2 or 3; n is 1-4 and l is 0, 1 or 2. Prepn. comprises reacting (II) with R3-COZ1 (III) or R4-NCO (IV) where X is H, halo, etc.

USE - ACAT inhibitors used to decrease cholesterol esterification and intestinal and intracellular uptake. Used to treat atherosclerosis, etc. at dosage e.g. 2-500 mg/kg/day.

ABEQ EP 421441 B UPAB: 19950301

Compounds represented by general formula (I) wherein R1 and R2, which are the same or different, each represent a hydrogen atom or a protective group for a hydroxyl group; R3 represents a saturated or unsaturated linear, branched or cyclic, monovalent C5-C25 -aliphatic hydrocarbon group which may be substituted with an aromatic group or a group of formula -NR4R5 where R4 represents a saturated or unsatd. linear, branched or cyclic, monovalent C5-C25 -aliphatic hydrocarbon group which may be substd. with an aromatic group, and R5 represents a hydrogen atom or a satd. or unsatd. linear, branched or cyclic, monovalent hydrocarbon group which may be substd. with an aromatic group; Q represents (a) a group of formula -X1-A-Y1-, where A represents a satd. or unsatd. linear, branched or cyclic divalent C2-C16 -aliphatic hydrocarbon group which may be substd. with an aromatic group, a divalent aromatic hydrocarbon of X1 and Y1 represents -NR6 and the other represents -O-, -S- or -NR7 in which R6 and R7 each represent a hydrogen atom or a C1 to C6 alkyl group; (b) a group of formula -X2-(CH2)t-Y2, where one of X2 and Y2 represents a group of formula (i), and the other represents -O-, -S- or -NR6 in which gp. (i) represents a 4-7 membered, divalent nitrogen-contg. non aromatic heterocyclic group and R6 has the same meaning as defined above, and l is

0, 1 or 2; or (c) a group of formula (ii) where m is 2 or 3; n is an integer of from 1 to 4, provided that if Q represents the group of formula  $-X1-A-Y1-$ , X1 represents  $-NR6$  and A is  $-CH2-CH2-$ , then Y1 cannot represent  $-S-$ .

Dwg.0/0

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 特 許 公 報 (B 2)

(11) 特許番号

第2532299号

(45) 発行日 平成 8 年(1996) 9 月11日

(24) 登録日 平成 8 年(1996) 6 月27日

(51) Int.Cl. <sup>6</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 C 235/12			C 0 7 C 235/12	
A 6 1 K 31/16	ABN		A 6 1 K 31/16	ABN
31/21			31/21	
31/255	ADN		31/255	ADN
31/335	AED		31/335	AED

請求項の数 1 (全 132 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願平2-265090

(22) 出願日 平成 2 年(1990) 10 月 4 日

(65) 公開番号 特開平3-218340

(43) 公開日 平成 3 年(1991) 9 月25日

(31) 優先権主張番号 特願平1 -261610

(32) 優先日 平 1 (1989) 10 月 6 日

(33) 優先権主張国 日本 (J P)

(73) 特許権者 999999999

富士テレビオ株式会社  
東京都新宿区西新宿 2 丁目 7 番 1 号

(72) 発明者 伊川 博  
東京都新宿区下落合 4 丁目 6 番 7 号 富  
士テレビオ株式会社内

(72) 発明者 松本 一  
東京都新宿区下落合 4 丁目 6 番 7 号 富  
士テレビオ株式会社内

(72) 発明者 小林 信雄  
東京都新宿区下落合 4 丁目 6 番 7 号 富  
士テレビオ株式会社内

(72) 発明者 楠 淳  
東京都新宿区下落合 4 丁目 6 番 7 号 富  
士テレビオ株式会社内

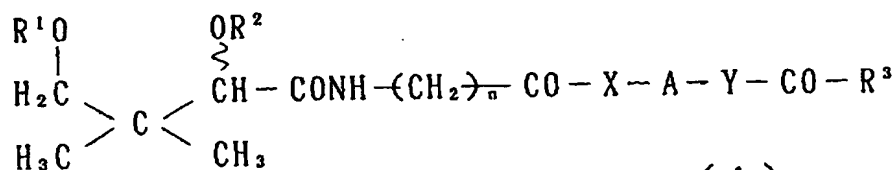
(74) 代理人 弁理士 下坂 スミ子

審査官 佐藤 修

(54) 【発明の名称】 バントテン酸誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】 一般式

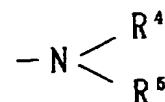


( 1 )

式中、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は同一もしくは相異なり、各々水素原子又は水  
酸基の保護基を表わし；

R<sup>3</sup>は飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしく  
は環状の芳香族基で置換されていてもよいC<sub>5</sub>~C<sub>25</sub>一価  
脂肪族炭化水素基又は基



を表わし、

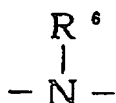
ここで、R<sup>4</sup>は飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖  
状もしくは環状のC<sub>5</sub>~C<sub>25</sub>一価脂肪族炭化水素基を表わ  
し、且つR<sup>5</sup>は水素原子又は飽和もしくは不飽和で且つ直  
鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換されてい

(2)

てもよい一価脂肪族炭化水素基を表わし；

Aは飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換されていてもよい $C_2 \sim C_{16}$ 二価脂肪族炭化水素基、二価芳香族炭化水素基又は二価芳香族複素環式基を表わし；

X及びYのいずれか一方は



を表わし且つ他方は $-O-$ 、 $-S-$ 又は



を表わし、

ここで、 $R^6$ 及び $R^7$ は各々水素原子又は低級アルキル基を表わし；

nは1～4の整数である、

で示される化合物。

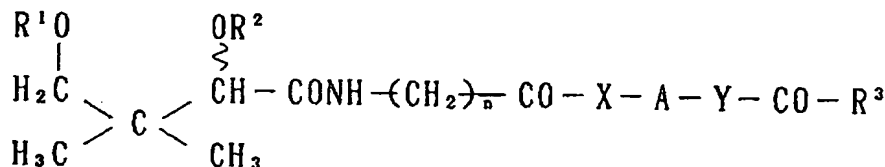
【発明の詳細な説明】

〈産業上の利用分野〉

本発明は、アシルCoA-コレステロール-アシル転位酵素 (Acyl CoA-Cholesterol-Acyltransferase—以下“ACAT”と略称する) の阻害活性に優れたパントテン酸誘導体に関する。

〈従来の技術及び課題〉

近年、動脈硬化症のうち一般的にみられる粥状硬化症においては、動脈硬化発症の最も初期から脂肪沈着が認められ、この蓄積する脂肪の主体はコレステロールであり、更に、数多くの病理組織学のおよび生化学的研究により、このコレステロールが血漿脂質に由来することが明らかになった。また、種々の疫学的調査によって、高脂血症は動脈硬化性疾患の主要な危険因子であることが示されている。従って、高脂血症の治療は動脈硬化性疾患のリスクを軽減する意味で益々重要となり、その治療薬についても単に血清脂質レベルを低下させるだけではなく、血清脂質バランスを改善し、或いは、動脈硬化の\*



(I)

式中、

$R^1$ 及び $R^2$ は同一もしくは相異なり、各々水素原子又は水酸基の保護基を表わし；

$R^3$ は飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換されていてもよい $C_5 \sim C_{25}$ 一価脂肪族炭化水素基又は基

4

\*発症を積極的に予防し得る薬剤の出現が望まれている。

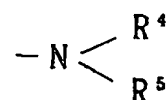
高脂血症治療薬としては既に数多くの薬剤が提供されており、総血清コレステロールの低下に関してはある程度の臨床的効果をあげているが、動脈硬化性疾患による死亡率の低減については必ずしも十分な効果が認められていない。また、近年、脂質代謝系の解明に伴い血清脂質バランスをコントロールする薬剤、即ち、高密度リポタンパク (HDL) の血清レベルを高め、低密度リポタンパク (LDL) のレベルを低下させるのに有効な薬剤或いは、コレステロールの生合成を阻害し結果として血清脂質レベルを低下させる薬剤 (HMGCoA reductase inhibitors) 等の開発が進められている。しかし、このような薬剤も血中脂質レベルの改善には有効ではあるが、腸管壁からの食事性コレステロールの吸収の制御には殆ど効果がなく、更に、動脈硬化の発症または進展を積極的に予防し得る作用を有しておらず、動脈硬化性疾患のリスクを軽減し得るものであるかどうかは今後の検討を待たなければならない。

一方、膜内在性酵素として知られるACATは肝臓および小腸の細胞内ミクロソームに多く存在し、コレステロールエステル合成を司っている。また、この酵素には、現在、二種のisozymeの存在が知られているが、これらの構造及びその生理的役割等については、この酵素の単離精製が困難なため未だ解明されていない。しかし、ACATはコレステロールの腸間における吸収及び細胞内へのコレステロールエステルとしての蓄積に関与し、動脈硬化巣ではその活性が上昇していることが知られており、本酵素の阻害剤は、コレステロール吸収阻害に基づく血中脂質低下作用と同時に抗動脈硬化作用を併せ持つ薬剤としての有用性が期待される。

そこで、本発明者らは優れたACAT阻害活性を有する物質を合成すべく鋭意研究を行なった結果、今回、本発明を完成するに至ったものである。

〈発明の開示〉

本発明によれば、下記一般式



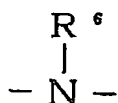
を表わし、

ここで、 $R^4$ は飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の $C_5 \sim C_{25}$ 一価脂肪族炭化水素基を表わし、且つ $R^5$ は水素原子又は飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換されてい

(3)

でもよい一価脂肪族炭化水素基を表わし；  
Aは飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換されていてもよい $C_2 \sim C_{16}$ 二価脂肪族炭化水素基、二価芳香族炭化水素基又は二価芳香族複素環式基を表わし；

X及びYのいずれか一方は



を表わし且つ他方は $-O-$ 、 $-S-$ 又は



を表わし、

ここで、 $R^6$ 及び $R^7$ は各々水素原子又は低級アルキル基を表わし；

nは1～4の整数である、

で示される化合物が提供される。

本明細書において「低級」なる語は、この語で修飾された原子団又は化合物の炭素数が6個以下好ましくは4個以下であることを表わすために使用するものである。

また、「水酸基の保護基」は加水分解又は水素添加分解により離脱することのできる任意の保護基であることができ、例えば以下に例示するものを挙げることができる。メチル、メトキシエチル、メチルチオメチル、ベンジルオキシメチル、 $t$ -ブトキシメチル、2-メトキシエトキシメチル、2,2,2-トリクロロエトキシメチル、ビス(2-クロロエトキシ)メチル、1-エトキシエチル、1-メチル-1-メトキシエチル、1-(イソプロポキシ)エチル、2,2,2-トリクロロエチル、 $t$ -ブチル、アリル、シンナミル、ベンジル、 $p$ -メトキシベンジル、 $o$ -ニトロベンジル、 $p$ -ニトロベンジル、 $p$ -クロロベンジル、 $o$ -クロロベンジル、 $p$ -シアノベンジル、ジフェニルメチル、 $\alpha$ -ナフチルジフェニルメチル、トリフェニルメチル、ジ( $p$ -メトキシフェニル)メチル等の置換又は無置換アルキル又はアルケニル基；テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、4-メトキシテトラヒドロピラニル、4-メトキシテトラヒドロチオピラニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチオフラニル等の複素環式基；トリメチルシリル、トリエチルシリル、イソプロピルジメチルシリル、 $t$ -ブチルジメチルシリル、 $t$ -ブチルジフェニルシリル、メチルジイソプロピルシリル、メチルジ $t$ -ブチルシリル、トリベンジルシリル、トリフェニルシリル、トリイソプロピルシリル等の置換シリル基；ホルミル、アセチル、プロピオニル、クロロアセチル、ジクロロアセチル、トリクロロアセチル、トリフルオロアセチル、メトキシアセチル、トリフェニルメトキシアセチル、フェノキシアセチル、 $p$ -クロロフェノキシアセチル、2,6-ジクロロ-4-メチルフェノキシアセチル、フェニルア

6

セチル、クロロジフェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル、3-ベンゾイルプロピオニル、イソブチロイル、モノスクシノイル、4-オキソペンタノイル、ピバロイル、2-ブテノイル、(E)-2-メチル-2-ブテノイル、ベンゾイル、2-クロロベンゾイル、3-ニトロベンゾイル、2-フルオロベンゾイル、3-トリフルオロメチルベンゾイル、3-トリクロロメチルベンゾイル、4-フェニルベンゾイル、2,4,6-トリメチルベンゾイル、 $\alpha$ -ナフトイル等のアシル基；メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、2,2,2-トリエトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、ビニルオキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、シンナミルオキシカルボニル、 $p$ -ニトロフェノキシカルボニル、ベンジルオキシカルボニル、 $p$ -メトキシベンジルオキシカルボニル、3,4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル、 $o$ -ニトロベンジルオキシカルボニル、 $p$ -ニトロベンジルオキシカルボニル等の置換オキシカルボニル基；フェニルカルバモイル、ナフチルカルバモイル、トルイルカルバモイル、フルオロフェニルカルバモイル、ジフルオロフェニルカルバモイル、ニトロフェニルカルバモイル、シアノフェニルカルバモイル、ベンジルカルバモイル、メチルカルバモイル、エチルカルバモイル、イソプロピルカルバモイル、ブチルカルバモイル、シクロヘキシルカルバモイル、シクロプロピルメチルカルバモイル、フェニルチオカルバモイル、ナフチルチオカルバモイル、トルイルチオカルバモイル、フルオロフェニルチオカルバモイル、ジフルオロフェニルチオカルバモイル、ニトロフェニルチオカルバモイル、シアノフェニルチオカルバモイル、ベンジルチオカルバモイル、プロピルチオカルバモイル、ブチルチオカルバモイル等の置換カルバモイル基など。

また、前記式(1)において $R^1$ 及び $R^2$ が水酸基の保護基を表わす場合には、 $R^1$ 及び $R^2$ とは一緒になって、メチレン、エチリデン、1- $t$ -ブチルエチリデン、1-フェニルエチリデン、2,2,2-トリクロロエチリデン、イソプロピリデン、ブチリデン、シクロペンチリデン、シクロヘキシリデン、シクロヘプチリデン、ベンジリデン、 $p$ -メトキシベンジリデン、2,4-ジメトキシベンジリデン、 $p$ -ジメチルアミノベンジリデン、 $o$ -ニトロベンジリデン、メトキシメチレン、エトキシメチレン、ジメトキシメチレン、1-メトキシエチリデン、1,2-ジメトキシエチリデン、 $\alpha$ -メトキシベンジリデン等のイリデン基を形成することもできる。

「飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の一価脂肪族炭化水素基」としては、例えば次のものが挙げられる。

(1) アルキル基：例えば、

メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、 $t$ -ブチル、ペンチル、ネオペンチル、イソペンチル、 $t$ -ペンチル、1-エチルペンチル、1-イ

(4)

7

ソプロピルペンチル、1-*t*-ブチルペンチル、2-エチルペンチル、2-イソプロピルペンチル、2-*t*-ブチルペンチル、3-エチルペンチル、3-イソプロピルペンチル、3-*t*-ブチルペンチル、ヘキシル、1-エチルヘキシル、1-イソプロピルヘキシル、1-*t*-ブチルヘキシル、2-エチルヘキシル、2-イソプロピルヘキシル、2-*t*-ブチルヘキシル、3-エチルヘキシル、3-イソプロピルヘキシル、3-*t*-ブチルヘキシル、ヘプチル、1-エチルヘプチル、1-イソプロピルヘプチル、1-ネオペンチルヘプチル、2-エチルヘプチル、2-イソプロピルヘプチル、2-ネオペンチルヘプチル、3-エチルヘプチル、3-イソプロピルヘプチル、3-ネオペンチルヘプチル、オクチル、1-エチルオクチル、1-イソプロピルオクチル、1-*t*-ブチルオクチル、2-エチルオクチル、3-イソプロピルオクチル、4-*t*-ブチルオクチル、ノニル、1-メチルノニル、1-エチルノニル、1-イソプロピルノニル、1-イソブチルノニル、2-メチルノニル、2-エチルノニル、3-イソプロピルノニル、4-イソブチルノニル、デシル、1-エチルデシル、1,1-ジエチルデシル、1-*t*-ブチルデシル、3-エチルデシル、1,3-ジエチルデシル、2-*t*-ブチルデシル、ウンデシル、1-イソプロピルウンデシル、1,1-ジエチルウンデシル、2-イソプロピルウンデシル、1,2-ジエチルウンデシル、ドデシル、1-*t*-ブチルドデシル、1-イソプロピルドデシル、1,1-ジエチルドデシル、2-*t*-ブチルドデシル、3-イソプロピルドデシル、2,4-ジエチルドデシル、トリデシル、1,1-ジエチルトリデシル、1-*t*-ブチルトリデシル、1,5-ジエチルトリデシル、3-*t*-ブチルトリデシル、テトラデシル、1-イソブチルテトラデシル、ペンタデシル、1-メチルペンタデシル、1,1-ジメチルペンタデシル、1-エトキシペンタデシル、1,1-ジエチルペンタデシル、1-イソプロピルペンタデシル、1-*t*-ブチルペンタデシル、2-イソブチルテトラデシル、3-メチルペンタデシル、2,6-ジメチルペンタデシル、2-エチルペンタデシル、1,4-ジエチルペンタデシル、3-イソプロピルペンタデシル、2-*t*-ブチルペンタデシル、ヘキサデシル、1,1-ジメチルヘキサデシル、1-メチルヘキサデシル、1-エチルヘキサデシル、1-イソプロピルヘキサデシル、1-*t*-ブチルヘキサデシル、1,3-ジメチルヘキサデシル、2-メチルヘキサデシル、4-エチルヘキサデシル、3-イソプロピルヘキサデシル、4-*t*-ブチルヘキサデシル、ヘプタデシル、1-メチルヘプタデシル、1,1-ジメチルヘプタデシル、1-エチルヘプタデシル、1-イソプロピルヘプタデシル、1-*t*-ブチルヘプタデシル、2-メチルヘプタデシル、3,5-ジメチルヘプタデシル、2-エチルヘプタデシル、5-イソプロピルヘプタデシル、3-*t*-ブチルヘプタデシル、オクタデシル、1-メチルオクタデシル、1,1

8

-ジメチルオクタデシル、1-エチルオクタデシル、1,1-ジエチルオクタデシル、2-メチルオクタデシル、2,3-ジメチルオクタデシル、5-エチルオクタデシル、1,2-ジエチルオクタデシル、ノナデシル、1-メチルノナデシル、1,1-ジメチルノナデシル、1-*t*-ブチルノナデシル、2-メチルノナデシル、2,3-ジメチルノナデシル、3-*t*-ブチルノナデシル、イコシル、1-メチルイコシル、1,1-ジメチルイコシル、1-エチルイコシル、1-*t*-ブチルイコシル、4-メチルイコシル、2,2-ジメチルイコシル、3-エチルイコシル、2-*t*-ブチルイコシルなど。

(2) アルケニル基：例えば

ビニル、1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、1-メチル-1-ブテニル、2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、1-エチル-3-ペンテニル、4-ペンテニル、1,3-ペンタジエニル、2,4-ペンタジエニル、1-ヘキセニル、1-メチル-2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、1-ブチル-5-ヘキセニル、1,3-ヘキサジエニル、2,4-ヘキサジエニル、1-ヘプテニル、2-ヘプテニル、3-ヘプテニル、4-ヘプテニル、5-ヘプテニル、6-ヘプテニル、1,3-ヘプタジエニル、2,4-ヘプタジエニル、1-オクテニル、2-オクテニル、3-オクテニル、4-オクテニル、5-オクテニル、6-オクテニル、7-オクテニル、1-ノネニル、2-ノネニル、3-ノネニル、4-ノネニル、5-ノネニル、6-ノネニル、7-ノネニル、8-ノネニル、9-デセニル、1-メチル-9-デセニル、1,1-ジメチル-9-デセニル、1-エチル-9-デセニル、6-ウンデセニル、1-メチル-6-ウンデセニル、1,1-ジメチル-6-ウンデセニル、6-トリデセニル、1-メチル-6-トリデセニル、1,1-ジメチル-6-トリデセニル、8-トリデセニル、1-メチル-8-トリデセニル、1,1-ジメチル-8-トリデセニル、10-トリデセニル、1-メチル-10-トリデセニル、1,1-ジメチル-10-トリデセニル、10-ペンタデセニル、1-メチル-10-ペンタデセニル、1,1-ジメチル-10-ペンタデセニル、8-ペンタデセニル、1-メチル-8-ペンタデセニル、1,1-ジメチル-8-ペンタデセニル、12-ヘプタデセニル、1-メチル-12-ヘプタデセニル、1,1-ジメチル-12-ヘプタデセニル、10-ヘプタデセニル、1-メチル-10-ヘプタデセニル、1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニル、8-ヘプタデセニル、1-メチル-8-ヘプタデセニル、1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニル、1-エチル-8-ヘプタデセニル、8,11-ヘプタデカジエニル、1-メチル-8,11-ヘプタデカジエニル、8,11,14-ヘプタデカトリエニルなど。

(3) アルキニル基：例えば

プロパギル、2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル

(5)

9

ル、2-ペンチニル、1-エチル-3-ペンチニル、1-イソプロピル-4-ペンチニル、1,3-ペンタジニル、2,4-ペンタジニル、1-ヘキシニル、1-メチル-2-ヘキシニル、2-メチル-3-ヘキシニル、1-エチル-4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1,3-ヘキサジニル、2,4-ヘキサジニル、1-ヘプチニル、1-メチル-2-ヘプチニル、3-ヘプチニル、1-エチル-4-ヘプチニル、2-プロピル-5-ヘプチニル、2-エチル-6-ヘプチニル、1,3-ヘプタジニル、2,4-ヘプタジニル、1-オクチニル、1-メチル-2-オクチニル、3-メチル-1-オクチニル、4-メチル-1-オクチニル、1-メチル-5-オクチニル、6-メチル-1-オクチニル、7-オクチニル、1-ノニル、2-メチル-1-ノニル、3-メチル-1-ノニル、1-メチル-4-ノニル、5-ノニル、6-メチル-1-ノニル、1-メチル-7-ノニル、8-ノニル、9-デシニル、1-メチル-9-デシニル、1,1-ジメチル-9-デシニル、1-エチル-9-デシニル、6-ウンデシニル、1-メチル-6-ウンデシニル、1,1-ジメチル-6-ウンデシニル、6-トリデシニル、1-メチル-6-トリデシニル、1,1-ジメチル-6-トリデシニル、8-トリデシニル、1-メチル-8-トリデシニル、1,1-ジメチル-8-トリデシニル、10-トリデシニル、1-メチル-10-トリデシニル、1,1-ジメチル-10-トリデシニル、10-ペンタデシニル、1-メチル-10-ペンタデシニル、1,1-ジメチル-10-ペンタデシニル、8-ペンタデシニル、1-メチル-8-ペンタデシニル、1,1-ジメチル-8-ペンタデシニル、12-ヘプタデシニル、1-メチル-12-ヘプタデシニル、1,1-ジメチル-12-ヘプタデシニル、10-ヘプタデシニル、1-メチル-10-ヘプタデシニル、1,1-ジメチル-10-ヘプタデシニル、8-ヘプタデシニル、1-メチル-8-ヘプタデシニル、1,1-ジメチル-8-ヘプタデシニル、1-エチル-8-ヘプタデシニル、8,11-ヘプタデカジニル、1-メチル-8,11-ヘプタデカジニル、8,11,14-ヘプタデカトリニルなど。

(4) シクロアルキル基：例えば

シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、パーヒドロナフチルなど。

(5) シクロアルケニル基：例えば

シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、シクロオクテニル、シクロペンタキエニル、シクロヘキサジエニル、シクロヘプタジエニル、シクロオクタジエニルなど。

(6) シクロアルキルアルキル基：例えば

シクロヘキシルメチル、シクロペンチルメチル、(4-イソプロピルシクロヘキシル)メチル、(4-t-ブチルシクロヘキシル)メチル、(4-ネオペンチルシクロ

10

ヘキシル)メチル、2-シクロペンチルエチル、2-シクロヘキシルエチル、3-シクロペンチルプロピル、3-シクロヘキシルプロピル、1-シクロペンチルベンチル、1-シクロヘキシルベンチル、1-シクロヘキシルメチルベンチル、3-シクロペンチルベンチル、2-シクロヘキシルベンチル、2-シクロヘキシルメチルベンチル、1-(4-t-ブチルシクロヘキシル)メチルベンチル、1-シクロペンチルヘキシル、1-シクロヘキシルヘキシル、1-シクロペンチルメチルヘキシル、2-シクロペンチルヘキシル、2-シクロヘキシルヘキシル、3-シクロペンチルメチルヘキシル、1-(4-ネオペンチルシクロヘキシル)メチルヘキシル、1-シクロペンチルヘプチル、1-シクロヘキシルメチルヘプチル、1-(4-イソプロピルシクロヘキシル)メチルヘプチル、3-シクロペンチルヘプチル、2-シクロヘキシルメチルヘプチル、4-(4-イソプロピルシクロヘキシル)メチルヘプチル、1-シクロペンチルオクチル、1-シクロヘキシルオクチル、1-シクロペンチルメチルオクチル、2-シクロペンチルオクチル、3-シクロヘキシルオクチル、2-シクロペンチルメチルオクチル、1-シクロペンチルノニル、1-シクロヘキシルノニル、1-シクロヘキシルメチルノニル、3-シクロペンチルノニル、2-シクロヘキシルノニル、2-シクロヘキシルメチルノニル、1-シクロペンチルデシル、1-シクロペンチルウンデシル、1-シクロヘキシルウンデシル、1-シクロペンチルドデシル、1-シクロペンチルトリデシル、2-シクロペンチルデシル、3-シクロペンチルウンデシル、3-シクロヘキシルウンデシル、2-シクロペンチルドデシル、2-シクロペンチルトリデシル、1-シクロペンチルテトラデシル、1-シクロヘキシルテトラデシル、2-シクロペンチルテトラデシル、3-シクロヘキシルテトラデシルなど。

(7) シクロアルケニルアルキル基：例えば

2-シクロヘキセン-1-イルメチル、1-シクロペンテン-1-イルメチル、2-(2-シクロペンテン-1-イル)エチル、2-(1-シクロヘキセン-1-イル)エチル、3-(1-シクロペンテン-1-イル)プロピル、3-(1-シクロヘキセン-1-イル)プロピル、4-(1-シクロヘキセン-1-イル)ブチル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)ベンチル、5-(1-シクロペンテン-1-イル)ベンチル、1-1-(シクロヘキセン-1-イル)ベンチル、5-(1-シクロヘキセン-1-イル)ベンチル、1-(1-シクロヘキセン-1-イル)ベンチル、1-(1-シクロヘキセン-1-イルメチル)ベンチル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)ヘキシル、6-(1-シクロペンテン-1-イル)ヘキシル、1-(1-シクロヘキセン-1-イル)ヘキシル、6-(シクロヘキセン-1-イル)ヘキシル、1-(2-シクロペンテン-1-イルメチル)ヘキシル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)ヘプチル、7-(1-シクロペンテン-1-イル)



(6)

11

ヘプチル、1-(1-シクロヘキセン-1-イルメチル)ヘプチル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)オクチル、1-(2-シクロペンテン-1-イル)オクチル、8-(2-シクロヘキセン-1-イル)オクチル、1-(1-シクロペンテン-1-イルメチル)オクチル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)ノニル、9-(1-シクロペンテン-1-イル)ノニル、1-(1-シクロヘキセン-1-イル)ノニル、9-(1-シクロヘキセン-1-イルメチル)ノニル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)デシル、10-(1-シクロペンテン-1-イル)ウンデシル、1-(2-シクロヘキセン-1-イル)ウンデシル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)ドデシル、1-(1-シクロペンテン-1-イル)トリデシル、1-(2-シクロペンテン-1-イル)テトラデシル、1-(3-シクロヘキセン-1-イル)テトラデシルなど。

(6) アルキルシクロアルキル基及びアルケニルシクロアルキル基：例えば

1-メチルシクロブチル、2-エチルシクロブチル、2-プロピルシクロブチル、1-ブチルシクロブチル、1-ペンチルシクロブチル、1-ヘキシルシクロブチル、1-ヘプチルシクロブチル、1-オクチルシクロブチル、1-ノニルシクロブチル、2-ペンチルシクロブチル、2-ヘキシルシクロブチル、2-ヘプチルシクロブチル、2-オクチルシクロブチル、2-ノニルシクロブチル、1-デシルシクロブチル、1-ウンデシルシクロブチル、1-ドデシルシクロブチル、1-ペンタデシルシクロブチル、1-(9-オクタデセニル)シクロブチル、1-メチルシクロペンチル、2-メチルシクロペンチル、1-エチルシクロペンチル、1-プロピルシクロペンチル、1-ブチルシクロペンチル、2-ブチルシクロペンチル、1-ペンチルシクロペンチル、1-ヘキシルシクロペンチル、3-ヘキシルシクロペンチル、1-ヘプチルシクロペンチル、1-オクチルシクロペンチル、2-オクチルシクロペンチル、1-デシルシクロペンチル、1-ドデシルシクロペンチル、1-トリデシルシクロペンチル、1-テトラデシルシクロペンチル、1-(9-オクタデセニル)シクロペンチル、1-メチルシクロヘキシル、1-エチルシクロヘキシル、1-プロピルシクロヘキシル、2-メチルシクロヘキシル、3-エチルシクロヘキシル、4-プロピルシクロヘキシル、1-ブチルシクロヘキシル、1-ペンチルシクロヘキシル、1-ヘキシルシクロヘキシル、4-ブチルシクロヘキシル、4-ペンチルシクロヘキシル、4-ヘキシルシクロヘキシル、1-ヘプチルシクロヘキシル、1-オクチルシクロヘキシル、1-ノニルシクロヘキシル、1-ウンデシルシクロヘキシル、1-ヘキサデシルシクロヘ

12

キシル、1-(9-オクタデセニル)シクロヘキシルなど。

(9) アルキルシクロアルケニル基及びアルケニルシクロアルケニル基：例えば

1-メチル-2-シクロペンテニル、1-エチル-2-シクロペンテニル、1-プロピル-2-シクロペンテニル、1-ブチル-2-シクロペンテニル、1-ペンチル-2-シクロペンテニル、1-ヘキシル-2-シクロペンテニル、1-ヘプチル-2-シクロペンテニル、1-オクチル-2-シクロペンテニル、2-メチル-2-シクロペンテニル、3-エチル-2-シクロペンテニル、2-プロピル-3-シクロペンテニル、3-ブチル-2-シクロペンテニル、2-ペンチル-2-シクロペンテニル、3-ヘキシル-3-シクロペンテニル、2-ヘプチル-2-シクロペンテニル、2-オクチル-3-シクロペンテニル、1-デシル-2-シクロペンテニル、1-ドデシル-2-シクロペンテニル、1-トリデシル-2-シクロペンテニル、1-テトラデシル-2-シクロペンテニル、1-(9-オクタデセニル)-2-シクロペンテニル、1-メチル-2-シクロヘキセニル、1-エチル-2-シクロヘキセニル、1-プロピル-2-シクロヘキセニル、1-ブチル-2-シクロヘキセニル、1-ペンチル-2-シクロヘキセニル、1-ヘキシル-2-シクロヘキセニル、1-ヘプチル-2-シクロヘキセニル、4-メチル-2-シクロヘキセニル、2-エチル-2-シクロヘキセニル、3-プロピル-2-シクロヘキセニル、4-ブチル-3-シクロヘキセニル、3-ペンチル-3-シクロヘキセニル、4-ヘキシル-3-シクロヘキセニル、4-ヘプチル-3-シクロヘキセニル、1-オクチル-2-シクロヘキセニル、1-ノニル-2-シクロヘキセニル、1-ウンデシル-2-シクロヘキセニル、1-ヘキサデシル-2-シクロヘキセニル、1-(9-オクタデセニル)-2-シクロヘキセニルなど。

「飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の芳香族基で置換された一価脂肪族炭化水素基」の「芳香族基」としては、例えば、フェニル、ナフチルの如き芳香族炭化水素基、フリール、チエニル、ピリジン、キノリル、イソキノリル、ピリダジニル、ピラジニル、インドリル、ベンゾオキサジアゾリル、イミダゾリル、ベンゾチアジアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリルの如き芳香族複素環式基を示すことができる。この芳香族基は置換されていてもよく、例えば、塩素原子、臭素原子、フッ素原子等のハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、シアノ基、ニトロ基、トリクロロメチル基、トリフルオロメチル基、ヒドロキシ基、フェニル基、フェノキシ基、低級アルキルチオ基等の置換基を挙げることができる。

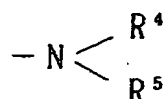
前記一般式においてはR<sup>3</sup>又はR<sup>4</sup>によって表わされうる飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環

(7)

13

状の一価脂肪族炭化水素基としては、上記のうちで、比較的長鎖のもの、すなわち炭素数が5~25個、好ましくは8~22個のものが使用され、一方、 $\text{R}^5$ によって表わされうる飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の一価脂肪族炭化水素基は短鎖のもの及び長鎖のもののいずれであってもよいが、一般には比較的短鎖のもの、好ましくは炭素数が1~10、より好ましくは1~8のものが適している。

しかして、前記一般式 (I) において $\text{R}^3$ により表わされうる基



の具体例としては、例えば、2-シクロペンチルエチルアミノ、2-シクロヘキシルエチルアミノ、3-シクロペンチルプロピルアミノ、3-シクロヘキシルプロピルアミノ、2-シクロペンチル-1-メチルエチルアミノ、2-シクロペンチル-1,1-ジメチルエチルアミノ、2-シクロヘキシル-1-メチルエチルアミノ、3-シクロペンチルプロピルアミノ、3-シクロヘキシルプロピルアミノ、4-シクロヘキシル-1,1-ジメチルブチルアミノ、1-メチルペンチルアミノ、1,1-ジメチルペンチルアミノ、1-エチルペンチルアミノ、1-シクロヘキシル-4-メチルペンチルアミノ、1-シクロペンチル-4-メチルペンチルアミノ、2-メチルペンチルアミノ、1,2-ジメチルペンチルアミノ、2-エチルペンチルアミノ、2-シクロヘキシル-4-メチルペンチルアミノ、2-シクロペンチル-4-メチルペンチルアミノ、3-メチルペンチルアミノ、1,3-ジメチルペンチルアミノ、3-エチルペンチルアミノ、1-シクロヘキシル-3-メチルペンチルアミノ、1-シクロペンチル-3-メチルペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、1-メチルヘキシルアミノ、1,1-ジメチルヘキシルアミノ、1-エチルヘキシルアミノ、1,1-ジエチルヘキシルアミノ、1-プロピルヘキシルアミノ、1-ブチルヘキシルアミノ、1-シクロペンチルヘキシルアミノ、2-メチルヘキシルアミノ、1,2-ジメチルヘキシルアミノ、2-エチルヘキシルアミノ、1,2-ジエチルヘキシルアミノ、2-プロピルヘキシルアミノ、2-ブチルヘキシルアミノ、6-シクロペンチルヘキシルアミノ、6-シクロヘキシルヘキシルアミノ、ヘプチルアミノ、1-エチルヘプチルアミノ、1,1-ジメチルヘプチルアミノ、1-シクロヘキシルヘプチルアミノ、1-シクロペンチルヘプチルアミノ、1-シクロヘキシルメチルヘプチルアミノ、1-シクロペンチルメチルヘプチルアミノ、オクチルアミノ、1,1-ジメチルオクチルアミノ、1-メチルオクチルアミノ、1-エチルオクチルアミノ、1,1-ジエチルオクチルアミノ、1-プロピルオクチルアミノ、1-ブチルオクチルアミノ、1-シクロペンチルオクチルアミノ、1-シクロヘキシルオクチル

14

アミノ、1-シクロペンチルメチルオクチルアミノ、1-シクロヘキシルメチルオクチルアミノ、ノニルアミノ、1-メチルノニルアミノ、1,1-ジメチルノニルアミノ、1-エチルノニルアミノ、1,1-ジエチルノニルアミノ、デシルアミノ、1-メチルデシルアミノ、1,1-ジメチルデシルアミノ、1-エチルデシルアミノ、1,1-ジエチルデシルアミノ、1-シクロペンチルデシルアミノ、1-シクロヘキシルデシルアミノ、1-シクロペンチルメチルデシルアミノ、1-シクロヘキシルメチルデシルアミノ、ウンデシルアミノ、1-メチルウンデシルアミノ、1,1-ジメチルウンデシルアミノ、ドデシルアミノ、1-メチルドデシルアミノ、1,1-ジメチルドデシルアミノ、テトラデシルアミノ、1-メチルテトラデシルアミノ、1,1-ジメチルテトラデシルアミノ、ペンタデシルアミノ、1-メチルペンタデシルアミノ、1,1-ジメチルペンタデシルアミノ、ヘキサデシルアミノ、1-メチルヘキサデシルアミノ、1,1-ジメチルヘキサデシルアミノ、ヘプタデシルアミノ、1-メチルヘプタデシルアミノ、1,1-ジメチルヘプタデシルアミノ、オクタデシルアミノ、1-メチルオクタデシルアミノ、1,1-ジメチルオクタデシルアミノ、3-シクロペンチル-2-プロペニルアミノ、3-シクロヘキシル-2-プロペニルアミノ、1,1-ジメチル-3-ブテニルアミノ、1-エチル-3-ブテニルアミノ、1-シクロプロピル-3-ブテニルアミノ、1-メチル-2-ペンテニルアミノ、1,1-ジメチル-2-ペンテニルアミノ、1-エチル-2-ペンテニルアミノ、1-シクロプロピル-2-ペンテニルアミノ、2-ヘキセニルアミノ、1-メチル-2-ヘキセニルアミノ、1,1-ジメチル-2-ヘキセニルアミノ、3-ヘキセニルアミノ、1-メチル-3-ヘキセニルアミノ、1,1-ジメチル-3-ヘキセニルアミノ、2-ヘプテニルアミノ、1-メチル-2-ヘプテニルアミノ、2-オクテニルアミノ、1-メチル-2-オクテニルアミノ、3-ノネニルアミノ、1-メチル-3-ノネニルアミノ、1,1-ジメチル-3-ノネニルアミノ、1-エチル-3-ノネニルアミノ、1-プロピル-3-ノネニルアミノ、8-ノネニルアミノ、1-メチル-8-ノネニルアミノ、1,1-ジメチル-8-ノネニルアミノ、1-エチル-8-ノネニルアミノ、9-デセニルアミノ、1-メチル-9-デセニルアミノ、1,1-ジメチル-9-デセニルアミノ、1-エチル-9-デセニルアミノ、6-ウンデセニルアミノ、1-メチル-6-ウンデセニルアミノ、1,1-ジメチル-6-ウンデセニルアミノ、6-トリデセニルアミノ、1-メチル-6-トリデセニルアミノ、1,1-ジメチル-6-トリデセニルアミノ、8-トリデセニルアミノ、1-メチル-8-トリデセニルアミノ、1,1-ジメチル-8-トリデセニルアミノ、10-トリデセニルアミノ、1-メチル-10-トリデセニルアミノ、1,1-ジメチル-10-トリデセニルアミノ、10-ペンタデセニルア

(8)

15

ミノ、1-メチル-10-ペンタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-10-ペンタデセニルアミノ、8-ペンタデセニルアミノ、1-メチル-8-ペンタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-8-ペンタデセニルアミノ、12-ヘプタデセニルアミノ、1-メチル-12-ヘプタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-12-ヘプタデセニルアミノ、10-ヘプタデセニルアミノ、1-メチル-10-ヘプタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニルアミノ、8-ヘプタデセニルアミノ、1-メチル-8-ヘプタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニルアミノ、1-エチル-8-ヘプタデセニルアミノ、8,11-ヘプタデカジエニルアミノ、1-メチル-8,11-ヘプタデカジエニルアミノ、8,11,14-ヘプタデカトリエニルアミノ、1-エチルシクロブチルアミノ、1-プロピルシクロブチルアミノ、1-ブチルシクロブチルアミノ、1-ペンチルシクロブチルアミノ、1-ヘキシルシクロブチルアミノ、1-ペンチルシクロブチルアミノ、1-オクチルシクロブチルアミノ、1-ノニルシクロブチルアミノ、1-デシルシクロブチルアミノ、1-ウンデシルシクロブチルアミノ、1-ドデシルシクロブチルアミノ、1-ペンタデシルシクロブチルアミノ、1-  
(9-オクタデセニル)シクロブチルアミノ、1-メチルシクロペンチルアミノ、1-エチルシクロペンチルアミノ、1-プロピルシクロペンチルアミノ、1-ブチルシクロペンチルアミノ、1-ヘキシルシクロペンチルアミノ、1-オクチルシクロペンチルアミノ、1-デシルシクロペンチルアミノ、1-ドデシルシクロペンチルアミノ、1-トリデシルシクロペンチルアミノ、1-テトラデシルシクロペンチルアミノ、1-(9-オクタデセニル)シクロペンチルアミノ、シクロヘキシルアミノ、1-メチルシクロヘキシルアミノ、1-プロピルシクロヘキシルアミノ、1-ペンチルシクロヘキシルアミノ、1-ヘプチルシクロヘキシルアミノ、1-ノニルシクロヘキシルアミノ、1-ウンデシルシクロヘキシルアミノ、1-ヘキサデシルシクロヘキシルアミノ、1-(9-オクタデセニル)シクロヘキシルアミノなどモノ置換アミノ基；

(2-シクロペンチルエチル)エチルアミノ、(2-シクロペンチルブチル)エチルアミノ、(2-シクロペンチルエチル)オクチルアミノ、(2-シクロヘキシルエチル)プロピルアミノ、(2-シクロヘキシルエチル)ペンチルアミノ、(2-シクロヘキシルエチル)デシルアミノ、(3-シクロペンチルプロピル)ヘプチルアミノ、(3-シクロヘキシルプロピル)オクチルアミノ、ブチル(2-シクロペンチル-1-メチルエチル)アミノ、(2-シクロペンチル-1,1-ジメチルエチル)ヘキシルアミノ、(2-シクロヘキシル-1-メチルエチル)デシルアミノ、(3-シクロペンチルプロピル)ヘキシルアミノ、(3-シクロヘキシルプロピル)オクチルアミノ、(4-シクロヘキシル-1,1-ジメチルブチ

16

ル)ペンチルアミノ、ヘキシル(1-メチルペンチル)アミノ、(1,1-ジメチルペンチル)ヘプチルアミノ、デシル(1-エチルペンチル)アミノ、ブチル(1-シクロヘキシル-4-メチルペンチル)アミノ、(1-シクロペンチル-4-メチルペンチル)ペンチルアミノ、デシル(2-メチルペンチル)アミノ、(1,2-ジメチルペンチル)ヘプチルアミノ、ドデシル(2-エチルペンチル)アミノ、ブチル(2-シクロヘキシル-4-メチルペンチル)アミノ、(2-シクロペンチル-4-メチルペンチル)プロピルアミノ、(3-メチルペンチル)オクチルアミノ、(1,3-ジメチルペンチル)ヘプチルアミノ、(3-エチルペンチル)ノニルアミノ、ブチル(1-シクロヘキシル-3-メチルペンチル)アミノ、(1-シクロペンチル-3-メチルペンチル)プロピルアミノ、ジヘキシルアミノ、ブチルヘキシルアミノ、ヘキシルオクチルアミノ、デシルヘキシルアミノ、(1-メチルヘキシル)ペンチルアミノ、デシル(1,1-ジメチルヘキシル)アミノ、(1-エチルヘキシル)ウンデシルアミノ、(1,1-ジエチルヘキシル)オクチルアミノ、ヘプチル(1-プロピルヘキシル)アミノ、(1-ブチルヘキシル)プロピルアミノ、ブチル(1-シクロペンチルヘキシル)アミノ、(2-メチルヘキシル)オクチルアミノ、デシル(1,2-ジメチルヘキシル)アミノ、(2-エチルヘキシル)テトラデシルアミノ、(1,2-ジエチルヘキシル)オクチルアミノ、ドデシル(2-プロピルヘキシル)アミノ、(2-ブチルヘキシル)オクチルアミノ、ブチル(6-シクロペンチルヘキシル)アミノ、(6-シクロヘキシルヘキシル)プロピルアミノ、ジヘプチルアミノ、(1-エチルヘプチル)トリデシルアミノ、(1,1-ジメチルヘプチル)ペンチルアミノ、(1-シクロヘキシルヘプチル)ペンチルアミノ、(1-シクロペンチルヘプチル)ヘキシルアミノ、ブチル(1-シクロヘキシルメチルヘプチル)アミノ、(1-シクロペンチルメチルヘプチル)プロピルアミノ、オクチルプロピルアミノ、ヘキシルオクチルアミノ、(1,1-ジメチルオクチル)ペンチルアミノ、ヘキシル(1-メチルオクチル)アミノ、(1-エチルオクチル)ペンチルアミノ、ブチル(1,1-ジエチルオクチル)アミノ、オクチル(1-プロピルオクチル)アミノ、(1-ブチルオクチル)ヘキシルアミノ、(1-シクロペンチルオクチル)ペンチルアミノ、ブチル(1-シクロヘキシルオクチル)アミノ、(1-シクロペンチルメチルオクチル)プロピルアミノ、(1-シクロヘキシルメチルオクチル)プロピルアミノ、ノニルプロピルアミノ、(1-メチルノニル)ヘプチルアミノ、(1,1-ジメチルノニル)ヘキシルアミノ、ブチル(1-エチルノニル)アミノ、(1,1-ジエチルノニル)プロピルアミノ、デシルエキシルアミノ、(1-メチルデシル)ペンチルアミノ、(1,1-ジメチルデシル)ヘキシルアミノ、ブチル(1-エチルデシル)アミノ、(1,1-ジ

(9)

17

エチルデシル) ペンチルアミノ、ブチル (1-シクロペンチルデシル) アミノ、(1-シクロヘキシルデシル) プロピルアミノ、(1-シクロペンチルメチルデシル) エチルアミノ、(1-シクロヘキシルメチルデシル) メチルアミノ、ブチルウンデシルアミノ、(1-メチルウンデシル) プロピルアミノ、(1,1-ジメチルウンデシル) プロピルアミノ、ブチルドデシルアミノ、(1-メチルドデシル) プロピルアミノ、(1,1-ジメチルドデシル) プロピルアミノ、プロピルテトラデシルアミノ、ブチル (1-メチルテトラデシル) アミノ、(1,1-ジメチルテトラデシル) プロピルアミノ、ブチルペンタデシルアミノ、ブチル (1-メチルペンタデシル) アミノ、(1,1-ジメチルペンタデシル) プロピルアミノ、エチルヘキサデシルアミノ、エチル (1-メチルヘキサデシル) アミノ、(1,1-ジメチルヘキサデシル) メチルアミノ、ヘプタデシルメチルアミノ、(1-メチルヘプタデシル) メチルアミノ、(1,1-ジメチルヘプタデシル) メチルアミノ、メチルオクタデシルアミノ、エチル (1-メチルオクタデシル) アミノ、(1,1-ジメチルオクタデシル) エチルアミノ、(3-シクロペンチル-2-プロペニル) ヘキシルアミノ、(3-シクロヘキシル-2-プロペニル) ヘプチルアミノ、(1,1-ジメチル-3-ブテニル) オクチルアミノ、(1-エチル-3-ブテニル) ノニルアミノ、(1-シクロプロピル-3-ブテニル) デシルアミノ、(1-メチル-2-ペンテニル) デシルアミノ、(1,1-ジメチル-2-ペンテニル) ノニルアミノ、デシル (1-エチル-2-ペンテニル) アミノ、(1-シクロプロピル-2-ペンテニル) ヘプチルアミノ、(2-ヘキセニル) オクチルアミノ、(1-メチル-2-ヘキセニル) ペンチルアミノ、デシル (1,1-ジメチル-2-ヘキセニル) アミノ、ブチル (3-ヘキセニル) アミノ、(1-メチル-3-ヘキセニル) オクテニルアミノ、(1,1-ジメチル-3-ヘキセニル) オクテニルアミノ、ジ (2-ヘプテニル) アミノ、(1-メチル-2-ヘプテニル) ヘプチルアミノ、(2-オクテニル) ペンチルアミノ、(1-メチル-2-オクテニル) ヘキシルアミノ、ヘプチル (3-ノネニル) アミノ、ヘキシル (1-メチル-3-ノネニル) アミノ、(1,1-ジメチル-3-ノネニル) ヘキシルアミノ、(1-エチル-3-ノネニル) ペンチルアミノ、ブチル (1-プロピル-3-ノネニル) アミノ、(8-ノネニル) ペンチルアミノ、(1-メチル-8-ノネニル) ペンチルアミノ、ブチル (1,1-ジメチル-8-ノネニル) アミノ、(1-エチル-8-ノネニル) ペンチルアミノ、(9-デセニル) プロピルアミノ、(1-メチル-9-デセニル) ペンチルアミノ、ブチル (1,1-ジメチル-9-デセニル) アミノ、(1-エチル-9-デセニル) プロピルアミノ、ペンチル (6-ウンデセニル) アミノ、ブチル (1-メチル-6-ウンデセニル) アミノ、(1,1-ジメチル-6-ウンデセニル) アミノ、

18

ル) プロピルアミノ、ペンチル (6-トリデセニル) アミノ、(1-メチル-6-トリデセニル) ペンチルアミノ、(1,1-ジメチル-6-トリデセニル) エチルアミノ、ブチル (8-トリデセニル) アミノ、ブチル (1-メチル-8-トリデセニル) アミノ、(1,1-ジメチル-8-トリデセニル) エチルアミノ、エチル (10-トリデセニル) アミノ、ブチル (1-メチル-10-トリデセニル) アミノ、(1,1-ジメチル-10-トリデセニル) プロピルアミノ、ブチル (10-ペンタデセニル) アミノ、ブチル (1-メチル-10-ペンタデセニル) アミノ、(1,1-ジメチル-10-ペンタデセニル) プロピルアミノ、(8-ペンタデセニル) プロピルアミノ、(1-メチル-8-ペンタデセニル) プロピルアミノ、エチル (1,1-ジメチル-8-ペンタデセニル) アミノ、ブチル (12-ヘプタデセニル) アミノ、エチル (1-メチル-12-ヘプタデセニル) アミノ、(1,1-ジメチル-12-ヘプタデセニル) プロピルアミノ、エチル (10-ヘプタデセニル) アミノ、(1-メチル-10-ヘプタデセニル) プロピルアミノ、(1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニル) エチルアミノ、(8-ヘプタデセニル) メチルアミノ、メチル (1-メチル-8-ヘプタデセニル) アミノ、(1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニル) エチルアミノ、(1-エチル-8-ヘプタデセニル) プロピルアミノ、(8,11-ヘプタデカジエニル) メチルアミノ、メチル (1-メチル-8,11-ヘプタデカジエニル) アミノ、(8,11,14-ヘプタデカトリエニル) メチルアミノ、(1-エチルシクロブチル) ペンチルアミノ、ヘプチル (1-プロピルシクロブチル) アミノ、(1-ブチルシクロブチル) ヘキシルアミノ、ブチル (1-ペンチルシクロブチル) アミノ、ヘプチル (1-ヘキシルシクロブチル) アミノ、(1-ペンチルシクロブチル) プロピルアミノ、エチル (1-オクチルシクロブチル) アミノ、プロピル (1-ノニルシクロブチル) アミノ、(1-デシルシクロブチル) エチルアミノ、メチル (1-ウンデシルシクロブチル) アミノ、(1-ドデシルシクロブチル) メチルアミノ、エチル (1-ペンタデシルシクロブチル) アミノ、メチル {1- (9-オクタデセニル) シクロブチル} アミノ、メチル (1-メチルシクロペンチル) アミノ、(1-エチルシクロペンチル) プロピルアミノ、プロピル (1-プロピルシクロペンチル) アミノ、(1-ブチルシクロペンチル) ペンチルアミノ、(1-ヘキシルシクロペンチル) メチルアミノ、メチル (1-オクチルシクロペンチル) アミノ、(1-デシルシクロペンチル) メチルアミノ、(1-ドデシルシクロペンチル) メチルアミノ、メチル (1-トリデシルシクロペンチル) アミノ、メチル {1- (9-オクタデセニル) シクロペンチル} アミノ、シクロヘキシルオクチルアミノ、ヘプチル (1-メチルシクロヘキシル) アミノ、ヘキシル (1-プロピルシクロヘキシル) アミ

(10)

19

ノ、ヘキシル（1-ベンチルシクロヘキシル）アミノ、ベンチル（1-ヘプチルシクロヘキシル）アミノ、ブチル（1-ノニルシクロヘキシル）アミノ、エチル（1-ウンデシルシクロヘキシル）アミノ、エチル（1-ヘキサデシルシクロヘキシル）アミノ、メチル〔1-（9-オクタデセニル）シクロヘキシル〕アミノ、ベンジルヘキシルアミノ、ベンジルヘプタイルアミノ、ベンジロクタイルアミノ、ベンジルデシルアミノ、ベンジルノニルアミノ、ベンジルウンデシルアミノ、ノニル（2-フェニルエチル）アミノ、ノニル（4-フェニルブチル）アミノ、4-ネオベンチルベンジルノニルアミノ、4-イソプロピルベンジルノニルアミノ、ヘプチル（4-ネオベンチルベンジル）アミノなどのジ置換アミノ基が挙げられる。

また、「飽和もしくは不飽和で且つ直鎖状、分岐鎖状もしくは環状の二価脂肪族炭化水素基」としては以下に例示するものを挙げることができる。

（1）アルキレン基及びシクロアルキルアルキレン基、例えば、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン、ヘプタメチレン、オクタメチレン、ノナメチレン、デカメチレン、プロピレン、エチルエチレン、イソプロピルエチレン、プロピルエチレン、ブチルエチレン、イソブチルエチレン、シクロベンチルエチレン、シクロヘキシルエチレン、シクロヘプチルエチレン、1,1-ジメチルエチレン、1-メチルトリメチレン、2-メチルトリメチレン、1-エチルトリメチレン、1-イソプロピルトリメチレン、1-イソブチルトリメチレン、1-シクロベンチルトリメチレン、1-シクロヘキシルトリメチレン、2-イソプロピルトリメチレン、2-イソブチルトリメチレン、2-シクロヘキシルトリメチレン、1-メチルテトラメチレン、1-イソプロピルテトラメチレン、1-イソブチルテトラメチレン、1-シクロベンチルテトラメチレン、1-シクロヘキシルテトラメチレン、2-メチルテトラメチレン、2-イソプロピルテトラメチレン、2-イソブチルテトラメチレン、2-シクロベンチルテトラメチレン、2-シクロヘキシルテトラメチレン、1-メチルペンタメチレン、1-エチルペンタメチレン、1-イソプロピルペンタメチレン、1-イソブチルペンタメチレン、1-シクロベンチルペンタメチレン、1-シクロヘキシルペンタメチレン、2-メチルペンタメチレン、2-エチルペンタメチレン、2-イソプロピルペンタメチレン、2-イソブチルペンタメチレン、2-シクロベンチルペンタメチレン、2-シクロヘキシルペンタメチレン、メチルペンタメチレン、3-エチルペンタメチレン、3-イソプロピルペンタメチレン、3-イソブチルペンタメチレン、3-シクロベンチルペンタメチレン、3-シクロヘキシルペンタメチレン、1-メチルヘキサメチレン、1-エチルヘキサメチレン、1-イソプロピルヘキサメチレン、1-イソブチルヘキサメチレン、1

20

1-シクロベンチルヘキサメチレン、1-シクロヘキシルヘキサメチレン、2-メチルヘキサメチレン、2-エチルヘキサメチレン、2-イソプロピルヘキサメチレン、2-イソブチルヘキサメチレン、2-シクロベンチルヘキサメチレン、2-シクロヘキシルヘキサメチレン、3-メチルヘキサメチレン、3-エチルヘキサメチレン、3-イソプロピルヘキサメチレン、3-イソブチルヘキサメチレン、3-シクロベンチルヘキサメチレン、3-シクロヘキシルヘキサメチレン、1-メチルヘプタメチレン、1-エチルヘプタメチレン、1-イソプロピルヘプタメチレン、1-イソブチルヘプタメチレン、1-シクロベンチルヘプタメチレン、1-シクロヘキシルヘプタメチレン、2-メチルヘプタメチレン、2-エチルヘプタメチレン、2-イソプロピルヘプタメチレン、2-イソブチルヘプタメチレン、2-シクロベンチルヘプタメチレン、2-シクロヘキシルヘプタメチレン、3-メチルヘプタメチレン、3-エチルヘプタメチレン、3-イソプロピルヘプタメチレン、3-イソブチルヘプタメチレン、3-シクロベンチルヘプタメチレン、3-シクロヘキシルヘプタメチレン、1-メチルオクタメチレン、1-エチルオクタメチレン、1-イソプロピルオクタメチレン、1-イソブチルオクタメチレン、1-シクロベンチルオクタメチレン、1-シクロヘキシルオクタメチレン、2-メチルオクタメチレン、2-エチルオクタメチレン、2-イソプロピルオクタメチレン、2-イソブチルオクタメチレン、2-シクロベンチルオクタメチレン、2-シクロヘキシルオクタメチレン、3-メチルオクタメチレン、3-エチルオクタメチレン、3-イソプロピルオクタメチレン、3-イソブチルオクタメチレン、3-シクロベンチルオクタメチレン、3-シクロヘキシルオクタメチレン、1-メチルノナメチレン、1-エチルノナメチレン、1-イソプロピルノナメチレン、1-イソブチルノナメチレン、1-シクロベンチルノナメチレン、1-シクロヘキシルノナメチレン、2-メチルノナメチレン、2-エチルノナメチレン、2-イソプロピルノナメチレン、2-イソブチルノナメチレン、2-シクロベンチルノナメチレン、2-シクロヘキシルノナメチレン、3-メチルノナメチレン、3-エチルノナメチレン、3-イソプロピルノナメチレン、3-イソブチルノナメチレン、3-シクロベンチルノナメチレン、3-シクロヘキシルノナメチレン、1-メチルデカメチレン、1-エチルデカメチレン、1-イソプロピルデカメチレン、1-イソブチルデカメチレン、1-シクロベンチルデカメチレン、1-シクロヘキシルデカメチレン、2-メチルデカメチレン、2-エチルデカメチレン、2-イソプロピルデカメチレン、2-イソブチルデカメチレン、2-シクロベンチルデカメチレン、2-シクロヘキシルデカメチレン、3-メチルデカメチレン、3-エチルデカメチレン、3-イソプロピルデカメチレン、3-イソブチルデカメチレン、3-シクロベンチル

(11)

21

デカメチレン、3-シクロヘキシルデカメチレンなどのC<sub>2</sub>~C<sub>16</sub>アルキレン基及びC<sub>5</sub>~C<sub>7</sub>シクロアルキル-C<sub>2</sub>~C<sub>10</sub>アルキレン基。

(2) シクロアルキレン基：例えば1,2-シクロペンチレン、1,3-シクロペンチレン、1,2-シクロヘキシレン、1,3-シクロヘキシレン、1,4-シクロヘキシレン、1,2-シクロヘプチレン、1,3-シクロヘプチレン、1,4-シクロヘプチレンなどC<sub>5</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキレン基。

(3) アルケニレン基及びアルキニレン基：例えば2-ブテニレン、1-メチル-2-ブテニレン、1-エチル-2-ブテニレン、2-プロピルブテニレン、1-ブチルブテニレン、2-ブチニレン、2-ペンテニレン、2-ペンチニレン、2-ヘキセニレン、3-ヘキセニレン、2-ヘキシニレン、3-ヘキシニレン、2-ヘプテニレン、3-ヘプテニレン、2-ヘプチニレン、3-ヘプチニレン、2-オクテニレン、4-オクテニレンなどのC<sub>4</sub>~C<sub>10</sub>アルケニレン基及びC<sub>4</sub>~C<sub>10</sub>アルキニレン基。

(4) シクロアルキレンアルキレン基：例えば1,1-ペンタメチレンエチレン、1,1-テトラメチレンエチレン、1,1-ヘキサメチレンエチレン、1,1-テトラメチレントリメチレン、1,1-ペンタメチレントリメチレン、1,2-トリメチレントリメチレン、1,2-テトラメチレントリメチレン、1,1-トリメチレンペンタメチレン、1,1-テトラメチレンペンタメチレン、1,1-ペンタメチレンペンタメチレン、1,2-トリメチレンペンタメチレン、1,2-テトラメチレンペンタメチレン、1,2-ペンタメチレンペンタメチレン、1,3-トリメチレンペンタメチレン、1,1-トリメチレンヘキサメチレン、1,1-テトラメチレンヘキサメチレン、1,1-ペンタメチレンヘキサメチレン、1,2-トリメチレンヘキサメチレン、1,2-テトラメチレンヘキサメチレン、1,2-ペンタメチレンヘキサメチレン、1,3-トリメチレンヘキサメチレン、1,1-トリメチレンヘプタメチレン、1,1-テトラメチレンヘプタメチレン、1,1-ペンタメチレンヘプタメチレン、1,2-トリメチレンヘプタメチレン、1,2-テトラメチレンヘプタメチレン、1,2-ペンタメチレンヘプタメチレン、1,3-トリメチレンヘプタメチレン、1,1-トリメチレンオクタメチレン、1,1-テトラメチレンオクタメチレン、1,1-ペンタメチレンオクタメチレン、1,2-トリメチレンオクタメチレン、1,2-テトラメチレンオクタメチレン、1,2-ペンタメチレンオクタメチレン、1,3-トリメチレンオクタメチレン、1,1-トリメチレンノナメチレン、1,1-テトラメチレンノナメチレン、1,1-ペンタメチレンノナメチレン、1,2-トリメチレンノナメチレン、1,2-テトラメチレンノナメチレン、1,2-ペンタメチレンノナメチレン、1,3-トリメチレンノナメチレン、1,1-トリメチレンデカメチレン、1,1-テトラメチレンデカメチレン、1,1-ペンタメチレンデカメチレン、1,2-トリメチレンデカメチレン、1,2-テトラメチレンデカメチレン、1,3-ペンタメチレンデカメチ

22

レン、1,3-トリメチレンデカメチレンなどのC<sub>4</sub>~C<sub>8</sub>シクロアルキレン-C<sub>1</sub>~C<sub>7</sub>アルキレン基。

上記の如き二価脂肪族炭化水素基はさらに、芳香族基例えば、フェニル、ナフチルなどのアリール基；フリル、チエニル、ピリジル、インドリルなどのヘテロアリール基で置換されていてもよく、そのように置換された二価脂肪族炭化水素基の例としては、フェニルエチレン、ナフチルエチレン、フリルエチレン、チエニルエチレン、ピリジルエチレン、ベンジルエチレン、ナフチルメチルエチレン、フリルメチルエチレン、チエニルメチルエチレン、ピリジルメチルエチレン、インドリルメチルエチレンなどが挙げられる。

「二価芳香族炭化水素基」としては単環式又は多環式のいずれであってもよく、例えば、フェニレンナフチレン等が挙げられ、これらは芳香環が1~4個の低級アルキル基で置換されていてもよい。

さらに「二価芳香族複素環式基」には、ヘテロ原子として窒素、酸素、イオン原子より選ばれる少なくとも1つのヘテロ原子を環中に含む芳香族性不飽和をもつ複素環式基が包含され、該複素環式基はさらに上記の如き芳香族炭化水素環と縮合環を形成していてもよい。そのような二価芳香族複素環式基の具体例を示せば次にとおりである。ピリジンジイル、ピリミジンジイル、ピリダジンジイル、ピラジンジイル、フランジイル、チオフェンジイル、キノリンジイル、イソキノリンジイル、ベンゾフランジイル、ベンゾチオフェンジイル、ベンズオキサゾールジイル、ベンズチアゾールジイル、インドールジイルなど。

本発明により提供される化合物中、好適なものとしては、前記一般式(I)において、

R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は同一もしくは相異なり、各々、水素原子；低級アルキル基、特にt-ブチル基；ハロゲン原子、低級アルコキシ基、ニトロ基もしくはシアノ基で置換されていてもよいベンジル基、特にベンジル、p-メトキシベンジル、o-ニトロベンジル、p-ニトロベンジル、p-クロロベンジル、o-クロロベンジル、p-シアノベンジル基；ジフェニルメチル基；アリル基；シンナミル基；

テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、4-メトキシテトラヒドロピラニル、4-メトキシテトラヒドロチオピラニル、テトラヒドロフラニル及びテトラヒドロチオフラニルより選ばれる複素環式基；又はアシル基、特にアセチル、プロピオニル、フェニルアセチル、クロロジフェニルアセチル、3-フェニルプロピオニル、3-ベンゾイルプロピオニル、イソブチロイル、ピバロイル、2-ブテノイル、(E)-2-メチル-2-ブテノイル、ベンゾイル、2-クロロベンゾイル、3-ニトロベンゾイル、2-フルオロベンゾイル、3-トリフルオロメチルベンゾイル、3-トリクロロメチルベンゾイル、4-フェニルベンゾイル、2,4,6-トリメチ

(12)

23

ルベンゾイル、 $\alpha$ -ナフトイルを表わすか、或いは

$R^1$ と $R^2$ は一緒になって1-*t*-ブチルエチリデン、1-フェニルエチリデン、イソプロピリデン、ブチリデン、シクロベンチリデン、シクロヘキシリデン、シクロヘプチリデン、ベンジリデン、*p*-メトキシベンジリデン、2,4-ジメトキシベンジリデン、*p*-ジメチルアミノベンジリデン及び*o*-ニトロベンジリデンより選ばれるイリデン基を表わし、

$R^3$ は

(1) 直鎖状もしくは1位に分岐鎖を有する $C_5 \sim C_{25}$ アルキル基、特にペンチル、1-イソプロピルペンチル、1-*t*-ブチルペンチル、ヘキシル、1-イソプロピルヘキシル、1-*t*-ブチルヘキシル、ヘプチル、1-イソプロピルヘプチル、1-*t*-ブチルヘプチル、オクチル、1-*t*-ブチルオクチル、ノニル、1-イソブチルノニル、デシル、1-エチルデシル、1,1-ジエチルデシル、1-*t*-ブチルデシル、ウンデシル、1-イソプロピルウンデシル、1,1-ジエチルウンデシル、ドデシル、1-*t*-ブチルドデシル、1-イソプロピルドデシル、1,1-ジエチルドデシル、トリデシル、1,1-ジエチルトリデシル、1-*t*-ブチルトリデシル、テトラデシル、1-イソブチルテトラデシル、ペンタデシル、1-メチルペンタデシル、1,1-ジメチルペンタデシル、1-エチルペンタデシル、1,1-ジエチルペンタデシル、1-イソプロピルペンタデシル、1-*t*-ブチルペンタデシル、ヘキサデシル、1,1-ジメチルヘキサデシル、1-メチルヘキサデシル、1-エチルヘキサデシル、1-イソプロピルヘキサデシル、1-*t*-ブチルヘキサデシル、ヘプタデシル、1-メチルヘプタデシル、1,1-ジメチルヘプタデシル、1-エチルヘプタデシル、1-イソプロピルヘプタデシル、1-*t*-ブチルヘプタデシル、オクタデシル、1-メチルオクタデシル、1,1-ジメチルオクタデシル、1-エチルオクタデシルもしくは1,1-ジエチルオクタデシル基；

(2) 直鎖状もしくは1位に分岐鎖を有する $C_{12} \sim C_{16}$ アルケニル基、特に、1,1-ジメチル-9-デセニル、1-エチル-9-デセニル、1-メチル-6-ウンデセニル、1,1-ジメチル-6-ウンデセニル、6-トリデセニル、1-メチル-6-トリデセニル、1,1-ジメチル-6-トリデセニル、8-トリデセニル、1-メチル-8-トリデセニル、1,1-ジメチル-8-トリデセニル、10-トリデセニル、1-メチル-10-トリデセニル、1,1-ジメチル-10-トリデセニル、10-ペンタデセニル、1-メチル-10-ペンタデセニル、1,1-ジメチル-10-ペンタデセニル、8-ペンタデセニル、1-メチル-8-ペンタデセニル、1,1-ジメチル-8-ペンタデセニル、12-ヘプタデセニル、1-メチル-12-ヘプタデセニル、1,1-ジメチル-12-ヘプタデセニル、10-ヘプタデセニル、1-メチル-10-ヘプタデセニル、1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニル、8-ヘプ

24

タデセニル、1-メチル-8-ヘプタデセニル、1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニル、1-エチル-8-ヘプタデセニル、8,11-ヘプタデカジエニル、1-メチル-8,11-ヘプタデカジエニルもしくは8,11,14-ヘプタデカトリエニル基；

(3)  $C_8 \sim C_{18}$ -アルキル- $C_4 \sim C_6$ シクロアルキル基、特に、1-オクチルシクロブチル、1-ノニルシクロブチル、1-デシルシクロブチル、1-ウンデシルシクロブチル、1-ドデシルシクロブチル、1-ペンタデシルシクロブチル、1-(9-オクタデセニル)シクロブチル、1-オクチルシクロペンチル、1-デシルシクロペンチル、1-ドデシルシクロペンチル、1-トリデシルシクロペンチル、1-テトラデシルシクロペンチル、1-(9-オクタデセニル)シクロペンチル、1-ノニルシクロヘキシル、1-ウンデシルシクロヘキシル、1-ヘキサデシルシクロヘキシルもしくは1-(9-オクタデセニル)シクロヘキシル基；或いは

(4) アルキル基又はアルケニル基でモノ-又はジ-置換された炭素数の合計が8~20のアミノ基、例えば1-イソプロピルペンチルアミノ、1-*t*-ブチルペンチルアミノ、1-イソプロピルヘキシルアミノ、1-*t*-ブチルヘキシルアミノ、1-イソプロピルヘプチルアミノ、1-*t*-ブチルヘプチルアミノ、1-*t*-ブチルオクチルアミノ、1-イソブチルノニルアミノ、デシルアミノ、1-エチルデシルアミノ、1,1-ジエチルデシルアミノ、1-*t*-ブチルデシルアミノ、ウンデシルアミノ、1-イソプロピルウンデシルアミノ、1,1-ジエチルウンデシルアミノ、ドデシルアミノ、1-*t*-ブチルドデシルアミノ、1-イソプロピルドデシルアミノ、1,1-ジエチルドデシルアミノ、トリデシルアミノ、1,1-ジエチルトリデシルアミノ、1-*t*-ブチルトリデシルアミノ、テトラデシルアミノ、1-イソブチルテトラデシルアミノ、ペンタデシルアミノ、1-メチルペンタデシルアミノ、1,1-ジメチルペンタデシルアミノ、1-エチルペンタデシルアミノ、1,1-ジエチルペンタデシルアミノ、1-イソプロピルペンタデシルアミノ、1-*t*-ブチルペンタデシルアミノ、ヘキサデシルアミノ、1,1-ジメチルヘキサデシルアミノ、1-メチルヘキサデシルアミノ、1-エチルヘキサデシルアミノ、1-イソプロピルヘキサデシルアミノ、1-*t*-ブチルヘキサデシルアミノ、ヘプタデシルアミノ、1-メチルヘプタデシルアミノ、1,1-ジメチルヘプタデシルアミノ、1-エチルヘプタデシルアミノ、1-イソプロピルヘプタデシルアミノ、1-*t*-ブチルヘプタデシルアミノ、オクタデシルアミノ、1-メチルオクタデシルアミノ、1,1-ジメチルオクタデシルアミノ、1-エチルオクタデシルアミノ、1,1-ジエチルオクタデシルアミノ、1,1-ジメチル-9-デセニルアミノ、1-エチル-9-デセニルアミノ、1-メチル-6-ウンデセニルアミノ、1,1-ジメチル-6-ウンデセニルアミノ、1-メチル-

(13)

25

6-トリデセニルアミノ、1,1-ジメチル-6-トリデセニルアミノ、8-トリデセニルアミノ、1-メチル-8-トリデセニルアミノ、1,1-ジメチル-8-トリデセニルアミノ、10-トリデセニルアミノ、1-メチル-10-トリデセニルアミノ、1,1-ジメチル-10-トリデセニルアミノ、10-ペンタデセニルアミノ、1-メチル-10-ペンタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-10-ペンタデセニルアミノ、8-ペンタデセニルアミノ、1-メチル-8-ペンタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-8-ペンタデセニルアミノ、12-ヘプタデセニルアミノ、1-メチル-12-ヘプタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-12-ヘプタデセニルアミノ、10-ヘプタデセニルアミノ、1-メチル-10-ヘプタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニルアミノ、8-ヘプタデセニルアミノ、1-メチル-8-ヘプタデセニルアミノ、1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニルアミノ、1-エチル-8-ヘプタデセニルアミノ、8,11-ヘプタデカジエニルアミノ、1-メチル-8,11-ヘプタデカジエニルアミノ、8,11,14-ヘプタデカトリエニルアミノ、1-ヘキシルシクロブチルアミノ、1-ヘプチルシクロブチルアミノ、1-オクチルシクロブチルアミノ、1-ノニルシクロブチルアミノ、1-デシルシクロブチルアミノ、1-ウンデシルシクロブチルアミノ、1-ドデシルシクロブチルアミノ、1-ペンタデシルシクロブチルアミノ、1-(9-オクタデセニル)シクロブチルアミノ、1-ベンチルシクロペンチルアミノ、1-ヘキシルシクロペンチルアミノ、1-ヘプチルシクロペンチルアミノ、1-オクチルシクロペンチルアミノ、1-デシルシクロペンチルアミノ、1-ドデシルシクロペンチルアミノ、1-トリデシルシクロペンチルアミノ、1-テトラデシルシクロペンチルアミノ、1-(9-オクタデセニル)シクロペンチルアミノ、1-ノニルシクロヘキシルアミノ、1-ウンデシルシクロヘキシルアミノ、1-ヘキサデシルシクロヘキシルアミノ、1-(9-オクタデセニル)シクロヘキシルアミノ、デシルヘキシルアミノ、オクチルプロピルアミノ、ヘキシルオクチルアミノ、(1-ブチルオクチル)ヘキシルアミノ、デシルヘキシルアミノ、ブチル(1-エチルデシル)アミノ、

(1,1-ジエチルデシル)ベンチルアミノ、ブチルウンデシルアミノ、ブチルドデシルアミノ、プロピルテトラデシルアミノ、ブチルペンタデシルアミノ、ブチル(1-メチルペンタデシル)アミノ、(1,1-ジメチルペンタデシル)プロピルアミノ、エチルヘキサデシルアミノ、エチル(1-メチルヘキサデシル)アミノ、(1,1-ジメチルヘキサデシル)メチルアミノ、ヘプタデシルメチルアミノ、メチル(1-メチルヘプタデシル)アミノ、(1,1-ジメチルヘプタデシル)メチルアミノ、メチルオクタデシルアミノ、エチル(1-メチルオクタデシル)アミノ、(1,1-ジメチルオクタデシル)エチルアミノ、ブチル(1,1-ジメチル-9-デセニル)アミ

26

ノ、(1-エチル-9-デセニル)プロピルアミノ、ベンチル(6-ウンデセニル)アミノ、ブチル(1-メチル-6-ウンデセニル)アミノ、(1,1-ジメチル-6-ウンデセニル)プロピルアミノ、ベンチル(6-トリデセニル)アミノ、(1-メチル-6-トリデセニル)ベンチルアミノ、(1,1-ジメチル-6-トリデセニル)エチルアミノ、ブチル(8-トリデセニル)アミノ、ブチル(1-メチル-8-トリデセニル)アミノ、(1,1-ジメチル-8-トリデセニル)エチルアミノ、エチル(10-トリデセニル)アミノ、ブチル(1-メチル-10-トリデセニル)アミノ、(1,1-ジメチル-10-トリデセニル)プロピルアミノ、ブチル(10-ペンタデセニル)アミノ、ブチル(1-メチル-10-ペンタデセニル)アミノ、(1,1-ジメチル-10-ペンタデセニル)プロピルアミノ、(8-ペンタデセニル)プロピルアミノ、(1-メチル-8-ペンタデセニル)プロピルアミノ、(1,1-ジメチル-8-ペンタデセニル)エチルアミノ、ブチル(12-ヘプタデセニル)アミノ、エチル(1-メチル-12-ヘプタデセニル)アミノ、(1,1-ジメチル-12-ヘプタデセニル)プロピルアミノ、エチル(10-ヘプタデセニル)アミノ、(1-メチル-10-ヘプタデセニル)プロピルアミノ、エチル(1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニル)アミノ、(8-ヘプタデセニル)メチルアミノ、メチル(1-メチル-8-ヘプタデセニル)アミノ、エチル(1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニル)アミノ、(1-エチル-8-ヘプタデセニル)プロピルアミノ、(8,11-ヘプタデカジエニル)メチルアミノ、メチル(1-メチル-8,11-ヘプタデカジエニル)アミノ、メチル(8,11,14-ヘプタデカトリエニル)アミノなどを表わし、

Aは、

(1) 直鎖状もしくは分岐鎖の $C_2 \sim C_{10}$ アルキレン基、例えば、エチレン、トリメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン、ヘプタメチレン、オクタメチレン、ノナメチレン、デカメチレン、プロピレン、エチルエチレン、イソプロピルエチレン、プロピルエチレン、ブチルエチレン、イソブチルエチレン、1-メチルトリメチレン、1-エチルトリメチレン、1-イソブチルトリメチレン、1-メチルテトラメチレン、1-イソプロピルテトラメチレンもしくは1-イソブチルテトラメチレン；

(2)  $C_5 \sim C_7$ シクロアルキル- $C_2 \sim C_5$ アルキレン基、例えば、シクロペンチルエチレン、シクロヘキシルエチレン、シクロヘプチルエチレン、1-シクロペンチルトリメチレン、1-シクロヘキシルトリメチレン、1-シクロペンチルテトラメチレンもしくは1-シクロヘキシルテトラメチレン；

(3)  $C_5 \sim C_7$ シクロアルキレン基、例えば、1,2-シクロペンチレン、1,3-シクロペンチレン、1,2-シクロヘキシレン、1,3-シクロヘキシレン、1,4-シクロヘキシ



(14)

27

レン、1,2-シクロヘブチレン、1,3-シクロヘブチレンもしくは1,4-シクロヘブチレン；

(4) C<sub>4</sub>~C<sub>8</sub>アルケニレンもしくはC<sub>4</sub>~C<sub>8</sub>アルキニレン基、例えば、2-ブテニレン、1-メチル-2-ブテニレン、1-エチル-2-ブテニレン、1-プロピルブテニレン、1-ブチルブテニレン、2-ブチニレン、2-ペンテニレン、2-ペンチニレン、2-ヘキセニレン、3-ヘキセニレン、2-ヘキシニレン、3-ヘキシニレン、2-ヘブテニレン、3-ヘブテニレン、2-ヘブチニレン、3-ヘブチニレン、2-オクテニレンもしくは4-オクテニレン；

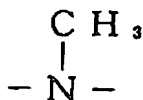
(5) C<sub>5</sub>~C<sub>7</sub>シクロアルキレン-C<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルキレン基、例えば、1,1-ペンタメチレンエチレン、1,1-テトラメチレンエチレン、1,1-ヘキサメチレンエチレン、1,1-ジメチルエチレン、1,1-テトラメチレントリメチレン、1,1-ペンタメチレントリメチレン、1,2-トリメチレントリメチレンもしくは1,2-テトラメチレントリメチレン；

(6) アリールもしくはヘテロアリール基で置換されたC<sub>2</sub>~C<sub>5</sub>アルキレン基、例えば、フェニルエチレン、ナフチルエチレン、フリルエチレン、チエニルエチレン、ピリジルエチレン、ベンジルエチレン、ナフチルメチルエチレン、フリルメチルエチレン、チエニルメチルエチレン、ピリジルメチルエチレン、インドリルメチルエチレン；或いは

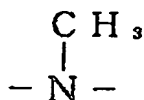
(7) o-フェニレン、m-フェニレン又はp-フェニレン

を表わし、

X及びYのいずれか一方は-NH-又は



を表わし且つ他方は-O-, -S-, -NH-又は



を表わし、

nが1~4の整数である

化合物が挙げられる。

かくして、本発明により提供される前記一般式(I)で示される化合物の代表例を示せば次のとおりである。

N-[4-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[4-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

28

4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,4-ジヒドロ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート

N-[4-(オレオイルチオ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[4-(オレオイルチオ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

10 S-[4-(オレオイルアミノ)フェニル] 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンチオエート

S-[4-(オレオイルアミノ)フェニル] 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンチオエート

N-[2-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

20 2-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

N-[2-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[2-(リノレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

30 N-[2-(リノレノイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[2-(ステアロイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[2-(ラウロイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[2-(オクタノイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

40 N-[3-(リノレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

N-[4-(ラウロイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

4-(リノレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

50 N-[2-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,4-シアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

(15)

29

N-〔2-(オレオイルアミノ)フェニル〕-3-〔N-  
 -(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブ  
 チル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-〔3-(オレオイルアミノ)フェニル〕-3-〔N-  
 -(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブ  
 チル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-〔3-(オレオイルアミノ)フェニル〕-3-〔N-  
 -(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブ  
 チル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-〔4-(オレオイルアミノ)フェニル〕-3-〔N-  
 -(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブ  
 チル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-〔4-(オレオイルアミノ)フェニル〕-3-〔N-  
 -(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブ  
 チル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-〔4-(オレオイルアミノ)フェニル〕-3-〔N-  
 -(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブ  
 チル)アミノ〕プロパンアミド  
 4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-〔N-(2,4-  
 -ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)  
 アミノ〕プロピオネート  
 N-〔4-(オレオイルオキシ)フェニル〕-3-〔N-  
 -(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブ  
 チル)アミノ〕プロパンアミド  
 S-〔4-(オレオイルアミノ)フェニル〕3-〔N-  
 -(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ  
 ル)アミノ〕プロパンチオエート  
 N-〔4-(オレオイルチオ)フェニル〕-3-〔N-  
 -(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ  
 ル)アミノ〕プロパンアミド  
 4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-〔N-(2,4-  
 -ジベンジルオキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ  
 ル)アミノ〕プロピオネート  
 N-(2-N-オレオイルアミノエチル)-3-〔N-  
 -(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ  
 ル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-(3-N-オレオイルアミノプロピル)-3-〔N-  
 -(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カル  
 ボニル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-(2-N-オレオイルアミノエチル)-3-〔N-  
 -(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ  
 ル)アミノ〕プロパンアミド  
 2-(N-オレオイルアミノ)エチル 3-〔N-(2,  
 2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
 ル)アミノ〕プロピオネート  
 2-(N-オレオイルアミノ)エチル 3-〔N-(2,  
 4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)  
 アミノ〕プロピオネート  
 3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-〔N-  
 -(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カル  
 ボニル)アミノ〕プロピオネート  
 3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-〔N-  
 -(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ

30

ル)アミノ〕プロピオネート  
 3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-〔N-  
 -(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ  
 ル)アミノ〕プロピオネート  
 4-(N-オレオイルアミノ)ブチル 3-〔N-(2,  
 2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
 ル)アミノ〕プロピオネート  
 4-(N-オレオイルアミノ)ブチル 3-〔N-(2,  
 4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)  
 アミノ〕プロピオネート  
 S-〔2-(N-オレオイルアミノ)エチル〕3-〔N-  
 -(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カル  
 ボニル)アミノ〕プロパンチオエート  
 S-〔2-(N-オレオイルアミノ)エチル〕3-〔N-  
 -(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブ  
 チル)アミノ〕プロパンチオエート  
 N-(3-オレオイルアミノプロピル)-3-〔N-  
 -(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カル  
 ボニル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-(3-オレオイルアミノプロピル)-3-〔N-  
 -(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ  
 ル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-(3-オレオイルアミノプロピル)-3-〔N-  
 -(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ  
 ル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-(4-オレオイルアミノブチル)-3-〔N-(2,  
 2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
 ル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-(4-オレオイルアミノブチル)-3-〔N-(2,  
 4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)  
 アミノ〕プロパンアミド  
 N-(4-オレオイルアミノブチル)-3-〔N-(2,  
 4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)  
 アミノ〕プロパンアミド  
 N-(6-オレオイルアミノヘキシル)-3-〔N-  
 -(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カル  
 ボニル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-(5-オレオイルアミノペンチル)-3-〔N-  
 -(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カル  
 ボニル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-(8-オレオイルアミノオクタール)-3-〔N-  
 -(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カル  
 ボニル)アミノ〕プロパンアミド  
 N-(2-オレオイルオキシエチル)-3-〔N-(2,  
 2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
 ル)アミノ〕プロパンアミド  
 5-(N-オレオイルアミノ)ペンチル 3-〔N-  
 -(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カル  
 ボニル)アミノ〕プロピオネート  
 6-(N-オレオイルアミノ)ヘキシル 3-〔N-



ピオネート

3-〔N-(2,2-ジメチル-11-ペンタデセノイル)アミノ〕プロピル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

3-[N-(2,2-ジメチル-9-ペンタデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

3-[N-(2,2-ジメチル-9-ヘキサデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

3-[N-(2,2-ジメチル-9-ヘプタデセノイル)アミノ]プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

3-〔N-(2,2-ジメチル-9-オクタデセノイル)アミノ〕プロピル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

3-〔N-(2-メチル-9-オクタデセノイル)アミノ〕プロピル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

N-〔2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル〕-3-〔N-{(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル}アミノ]プロパンアミド

N-〔(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサ-1-イル〕-3-〔N-〔(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル〕アミノ〕プロパンアミド

N-〔(1R,2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサ-1-イル〕-3-〔N-{(2R)-2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル}アミノ〕プロパンアミド

N-〔(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサ-1-イル〕-3-〔N-〔(2R)-2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル〕アミノ〕プロパンアミド

N-〔2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル〕-3-〔N(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ〕プロパンアミド

N-〔2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル〕-3-〔N(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ〕プロパンアミド

N-〔(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル〕-3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジジオキサラン-4-カルボニル)アミノ〕

プロパンアミド

(1R, 2R) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサン  
- 1 - イル] 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル -  
1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオ  
ネート

(1S, 2S) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサン  
- 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 -  
ジオキサラン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネー  
ト

10 (1R, 2R) - 2 - (ステアロイルアミノ) シクロヘキサ  
ン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル -  
1, 3 - ジオキサソ - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオ  
ネート

(1S, 2S) - 2 - (リノレオイルアミノ) シクロヘキサ  
ン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル -  
1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオ  
ネート

2- (1-オクチルシクロブタノイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル 3- [N- (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

2-(1-ノニルシクロブタノイルアミノ)シクロヘキサ  
 ン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル  
 -1,3-ジオキサソ-4-カルボニル)アミノ]プロピ  
 オネート

2- (オレオイルアミノ) シクロペンタン-1-イル  
3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ  
-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

2- (オレオイルアミノ) シクロヘプタン-1-イル  
3- [N- (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサソ  
-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

3-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ  
-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

4-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ  
-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-デシルシクロブチルカルボニルアミノ)シクロ  
 40   ロヘキサン-1-イル   3-[N-(2,2,5,5-テトラ  
       メチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]  
       プロピオネート

2 - (1 - ウンデシルシクロブチルカルボニルアミノ) シクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

2-(1-ペンタデシルシクロブチルカルボニルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

50 2-〔1-(9-オクタデセニル)シクロブチルカルボ

(18)

35

ニルアミノ) シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

2-(1-デシルシクロペンチルカルボニルアミノ)シクロヘキサノール 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサノ-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-トリデシルシクロペンチルカルボニルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-デシルシクロヘキシルカルボニルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-ノニルシクロヘキシルカルボニルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-[1-(9-オクタデセニル)シクロヘキシルカルボニルアミノ]シクロヘキサノール 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサノール-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-イソプロピルベンチルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-イソプロピルヘキシルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-t-ブチルドデシルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2- (1,1-ジメチルヘキサデシルカルバモイルアミノ)シクロヘキサノン-1-イル 3- [N- (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサノン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(オクタデシルカルバモイルアミノ)シクロヘキサ  
ン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-  
1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオ  
ネート

2-(1,1-ジメチルオクタデシルカルバモイルアミノ)シクロヘキサノール 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサノ-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1,1-ジメチル-9-デセニルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)

36

アミノ] プロピオネート

2 - (1,1-ジメチル-9-ウンデセニルカルバモイル  
アミノ)シクロヘキサン-1-イル 3 - [N-(2,2,  
5,5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニ  
ル)アミノ]プロピオネート

2 - (1,1-ジメチル-8-トリデセニルカルバモイル  
アミノ)シクロヘキサン-1-イル 3 - [N-(2,2,  
5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
ル)アミノ]プロピオネート

10 2-(1-メチル-10-ペンタデシルカルバモイルア  
ミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,  
5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニル)  
アミノ]プロピオネート

2 - (1,1-ジメチル-10-ヘプタデセニルカルバモイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル 3 - [N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

2 - (1 - メチル - 8 - ペンタデシルカルバモイルア  
ミノ) シクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5,  
5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル)  
アミノ] プロピオネート

2-(8-オクタデセニルカルバモイルアミノ)シクロ  
ヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメ  
チル-1,3-ジオキサシ-4-カルボニル)アミノ]プ  
ロピオネート

2-(8,11-オクタデカジエニルカルバモイルアミノ)シクロヘキサ-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

30 2-(1-メチル-8,11,14-オクタデカトリエニルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-ヘキシルシクロブチルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-オクチルシクロブチルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-オクチルシクロペンチルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-オクチルシクロヘキシルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

50 2-(1-ヘプチルシクロペンチルカルバモイルアミ

(19)

37

ノ) シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2 - (1 - デシルシクロペンチルカルバモイルアミノ) シクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキササン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

2-(1-ヘキシルシクロヘキシルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-[1-(6-ヘキサデセニル)シクロヘキシルカルバモイルアミノ]シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-[1-(6-ヘキサデセニル)シクロブチルカルバモイルアミノ]シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-[1-(6-ヘキサデセニル)シクロペンチルカルバモイルアミノ]シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2 - (デシルヘキシルカルバモイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

2-(ヘキシルオクチルカルバモイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(ブチルデシルカルバモイルアミノ)シクロヘキサ-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(メチルオクタデシルカルバモイルアミノ)シクロ  
ヘキサノー-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメ  
チル-1,3-ジオキサノー-4-カルボニル)アミノ]プ  
ロピオネート

2-〔ブチル(1,1-ジメチル-6-ウンデセニル)カルバモイルアミノ〕シクロヘキサノ-1-イル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサノ-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

2-〔ブチル(1,1-ジメチル-8-トリデセニル)カルバモイルアミノ〕シクロヘキサン-1-イル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

2-〔ブチル(1,1-メチル-10-ペンタデロニル)カルバモイルアミノ〕シクロヘキサノ-1-イル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサノ-4-

38

—カルボニル) アミノ] プロピオネート

2-〔(8-ペンタデセニル)プロピルカルバモイルア  
ミノ〕シクロヘキサン-1-イル 3-〔N-(2,2,5,  
5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)  
アミノ〕プロピオネート

2-〔ブチル(1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニル)カルバモイルアミノ〕シクロヘキサノ-1-イル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサノ-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

10 2-〔(1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニル) エチル  
カルバモイルアミノ〕シクロヘキサン-1-イル 3-  
〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4  
-カルボニル) アミノ〕プロピオネート

2-メチル-2-(N-オレオイルアミノ)エチル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

2-エチル-2-(N-オレオイルアミノ)エチル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

20 2-イソプロピル-2-(N-オレオイルアミノ)エチ  
ル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキ  
サン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-イソブチル-2-(N-オレオイルアミノ)エチル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ  
ン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2,2-ペンタメチレン-2-(N-オレオイルアミノ)  
エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジ  
オキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-フェニル-2-(N-オレオイルアミノ)エチル  
30 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ  
-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-ベンジル-2-(N-オレオイルアミノ)エチル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ  
-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-ナフチル-2-(N-オレオイルアミノ)エチル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ  
-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(2-フリル)-2-(N-オレオイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-シクロペンチル-2-(N-オレオイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(3-インドリル)メチル-2-(N-オレオイル  
アミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル  
-1,3-ジオキサシ-4-カルボニル)アミノ]プロピ  
オネート

4-(N-オレオイルアミノ)-2-ブテニル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ  
50 -4-カルボニル)アミノ]プロピオネート



(21)

41

シクロヘプタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テ  
トラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミ  
ノ]プロピオネート

2 - (1 - オクチルシクロペンチルカルバモイルアミノ) シクロヘプタン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサソ - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

2-(1-オクチルシクロヘキシルカルバモイルアミノ)シクロヘプタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-ヘプチルシクロペンチルカルバモイルアミノ)シクロペンタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサシラン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-デシルシクロペンチルカルバモイルアミノ)シクロペンタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(1-ヘキシルシクロヘキシルカルバモイルアミノ)シクロヘプタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-[1-(6-ヘキサデセニル)シクロヘキシルカルバモイルアミノ]シクロペンタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-〔1-(6-ヘキサデセニル)シクロブチルカルバ  
モイルアミノ〕シクロペンタン-1-イル 3-[N-(  
2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カル  
ボニル)アミノ]プロピオネート

2-[1-(6-ヘキサデセニル)シクロペンチルカルバモイルアミノ]シクロヘプタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(デシルヘキシルカルバモイルアミノ)シクロペン  
タン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル  
-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピ  
オネート

2-(ヘキシロクチルカルバモイルアミノ)シクロヘ  
 プタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチ  
 ル-1,3-ジオキサ-4-カルボニル)アミノ]プロ  
 ピオネート

2-〔ブチル(1,1-ジメチル-8-ヘプタデセニル)カルバモイルアミノ〕シクロペンタン-1-イル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

2-メチル-2-(N-リノレオイルアミノ)エチル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ  
-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

42

2-メチル-2-[N-(2-イソプロピルヘキサノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-メチル-2-[N-(2-t-ブチルヘプタノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-メチル-2-[N-(2,2-ジエチルウンデカノイル)アミノ]エチル-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-メチル-2-[N-(2,2-トリメチレンデカノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-エチル-2-(N-リノレノイルアミノ)エチル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ  
-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

20 2-イソプロピル-2-[N-(2-イソプロピルヘプ  
タデカノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-  
テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)  
アミノ]プロピオネート

2-イソブチル-2-[N-(2-エチルオクタデカノ  
イル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラ  
メチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニル)アミノ]  
プロピオネート

2,2-ペンタメチレン-2-(N-リノレイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-フェニル-2-(N-リノレイルアミノ)エチル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ  
ン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-ベンジル-2-(N-リノレイルアミノ)エチル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ  
ン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-ナフチル-2-[N-(2,2-ジメチル-9-テトラデセノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

2-(2-フリル)-2-[N-(2,2-ジメチル-9-  
-オクタデセノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,  
2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ-4-カルボニ  
ル)アミノ]プロピオネート

2-シクロペンチル-2-[N-(2,2-ジメチル-9-  
-オクタデセノイル)アミノ]エチル 3-[N-(2,  
2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ-4-カルボニ  
ル)アミノ]プロピオネート

50 2-(3-インドリル)メチル-2-(N-リノレオイ



(22)

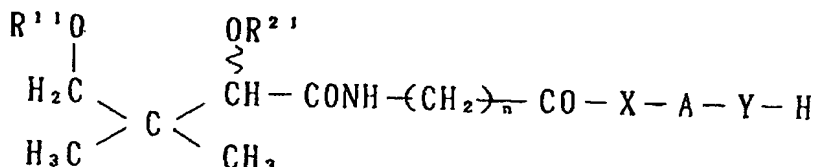
43

ルアミノ) エチル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ〕プロピオネート

2-(8-ヘプタデセニルカルバモイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル 2-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ〕アセテート

2-(1-メチル-8-ヘプタデセニルカルバモイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル 4-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ〕ブチレート

\*



(II)

式中、

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は同一もしくは相異なり、各々水酸基の保護基を表し；

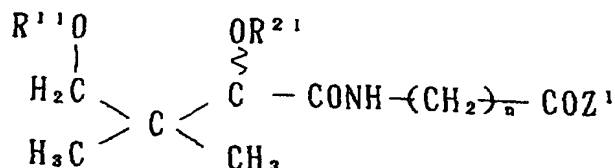
A, X, Yおよびnは前記定義のとおりである、で示される化合物を下記式



又は



※



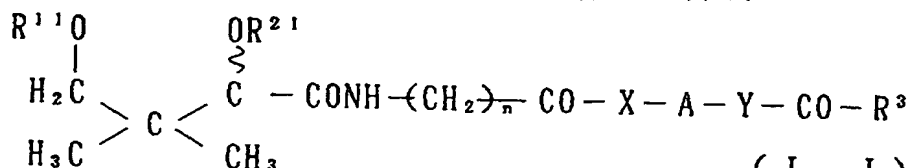
(V)

式中、

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, nおよびZ<sup>1</sup>は前記定義のとおりである、で示される化合物を下記式



☆



(I-I)

式中、

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, A, X, Yおよびnは前記定義のとおりである、

で示される化合物から水酸基の保護基を脱離せしめることにより製造することができる。

方法(a)における式(II)の化合物と式(III)の化合物との反応ならびに方法(b)における式(V)の化合物と式(VI)の化合物との反応は通常適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トリエン、キシレン等の芳香族

50

44

\* 2-(1-メチル-8-ヘプタデセニルカルバモイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル 5-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ〕バレエート

本発明の化合物は、前記一般式(I)において\*印で示すように、不斉炭素原子を少なくとも1個含有しており、光学活性体(R-体またはS-体)またはラセミ体のいずれの形態のものをも含有するものである。

本発明の化合物は、例えば、

(a) 下記式

※ 式中、Z<sup>1</sup>は水酸基; Cl, Br等のハロゲン原子; メトキ

シ、エトキシ等のアルコキシ基; フェノキシ、p-ニトロフェノキシ、2,4-ジニトロフェノキシ等の置換もしくは未置換のフェニルオキシ基を表わし；

R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は前記定義のとおりである、で示される化合物を反応させるか、或いは

(b) 下記式

☆ 式中、

R<sup>3</sup>, A, XおよびYは前記定義のとおりである、

で示される化合物とを反応させ、そして必要に応じて

(c) 得られる下記式

炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；水などの単独または混合溶媒中で行うことができる。この反応は一般に-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約-10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内で行うことができる。また、

(23)

45

方法 (a) および方法 (b) においては、反応に触媒または反応促進剤を使用することもできる。使用しうる触媒または反応促進剤としては、例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類が

あげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物 (II) または化合物 (IV) に対して 0.01~10 当量、好ましくは 0.1~1.1 当量の範囲内で使用することができる。

また、化合物 (III) 又は (IV) の化合物 (II) に対する使用割合は厳密に制限されるものではないが、化合物 (III) 又は (IV) は化合物 (II) 1 モルに対して通常 0.8~1.2 モル、好ましくは 1.0~1.1 モルの範囲内で使用することができる。同様に、化合物 (V) は化合物

(VI) 1 モルに対して通常 0.8~1.2 モル、好ましくは 1.0~1.1 モルの範囲内で使用することができる。

方法 (c) において化合物 (I-I) から水酸基の保護基を脱離せしめる反応は、溶媒中、適当な触媒の存在下に加水分解することにより行うことができる。例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチレンエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハ

46

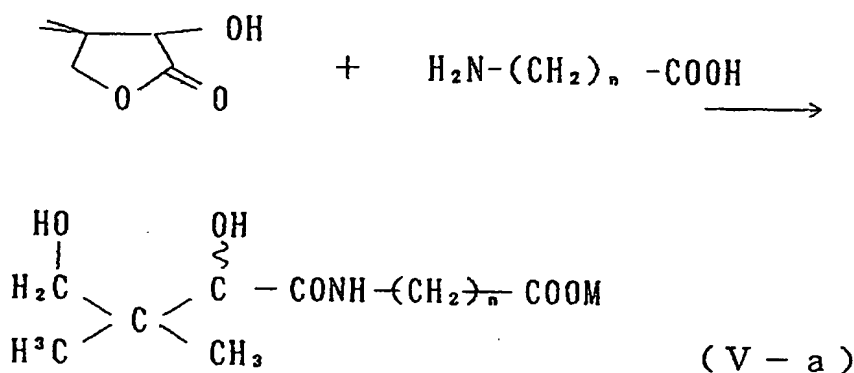
ロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；水；酢酸、プロピオン酸等の有機酸類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類を単独または混合溶媒中で -78℃ から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約 -10℃ から使用溶媒の沸点温度の範囲内で行うことができる。使用できる触媒としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；塩酸、硝酸、硫酸等の鉱酸類；フッ化水素、臭化水素、ヨウ化水素等のハロゲン化水素類；トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸等の有機酸類があげられる。また、適当な金属触媒を用いて、常法に従い接触水素添加することにより保護基を脱離させることもできる。その際に使用しうる金属触媒としては、ニッケル、パラジウム、ロジウム、白金等の通常の水素添加触媒が用いられる。

上記の各方法で得られる生成物は、それ自体既知の方法、例えば結晶化、クロマトグラフィー、抽出、濾過等の方法を適宜組合わせて使用することにより、反応混合物から分離し又は精製することができる。

上記の方法において出発原料として使用される式 (V)、(II) 及び (VI) の化合物は、以下に述べるようにして製造することができる。

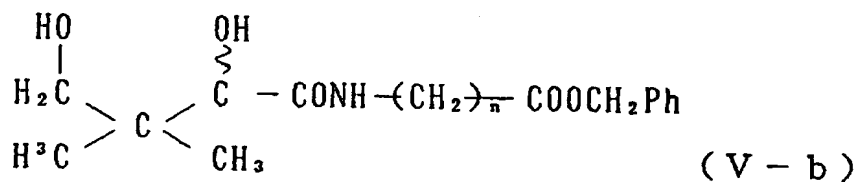
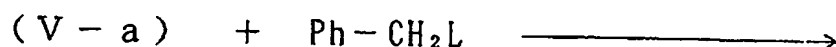
〔式 (V) の化合物の製造〕

### 工程 1 :

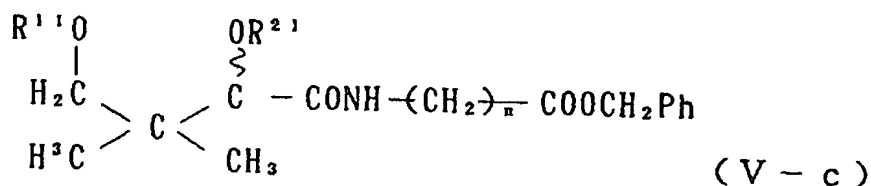
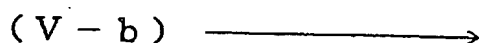


(24)

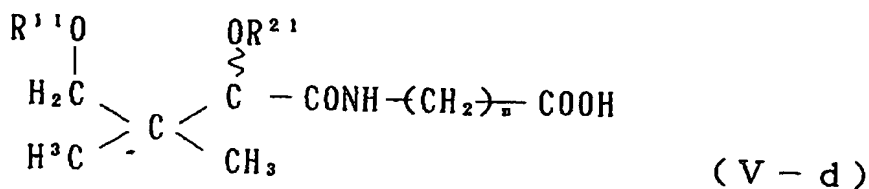
47  
工程 2 :



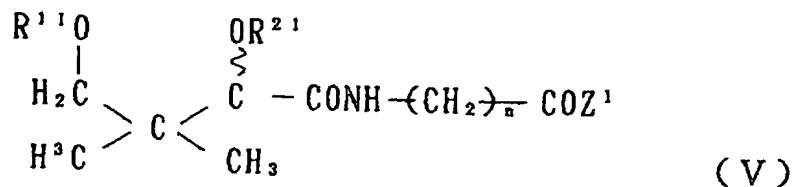
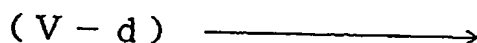
工程 3 :



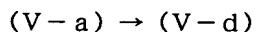
工程 4 :



工程 5 :



工程6:



上記式中、Mは水素原子；ナトリウム、カリウム等のアルカリ金属原子またはマグネシウム、カルシウム等のアルカリ土類金属原子を表わし、LはOH, Cl, Br, IまたはN<sub>2</sub>を表わし、R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, n及びZ<sup>1</sup>は前記定義のとおりである。

工程1:

この工程はバントイルラクトンと、ω-アミノカルボン酸とを反応させて化合物(V-a)を合成するもので

ある。バントイルラクトンは(D)-, (L)-及び(DL)-体のいずれであってもよい。ω-アミノカルボン酸の例としては、アミノ酢酸(グリシン)、3-アミノプロピオン酸(β-アラニン)、4-アミノ酪酸(γ-アミノ酪酸、GABA)、5-アミノ吉草酸等があげられる。反応は溶媒を用いて行なうことが好ましく、例えば、ベンゼン、トリエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール

(25)

49

ル等のアルコール類；水を単独でまたは混合して使用することができる。この反応は一般に約 0℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは、室温から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行うことができる。この反応には触媒を用いることが好ましく、かかる触媒としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類があげられる。これら触媒はパントイルラクトンに対して 0.01～10 当量、好ましくは 0.1～1.1 当量の範囲内で使用することができる。

工程 2:

この工程は、工程 1 で合成された化合物 (V-a) をベンジル化して化合物 (V-b) に変換するものである。ベンジル化の試薬としては、塩化ベンジル、臭化ベンジル、ヨウ化ベンジル等のハロゲン化ベンジル類；ベンジルアルコール；フェニルジアゾメタン等が用いられる。この反応は、適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水などの単独または混合溶媒中で、通常 -78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは、-10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行うことができる。また、この反応には触媒または反応促進剤を使用することもできる。かかる触媒または反応促進剤としては、例えばジシクロヘキシルカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物 (V-a) に対して 0.01～10 当量、好ましくは 0.1～1.1 当量の範囲内で使用することができる。

工程 3:

この工程は、前工程 2 において合成された化合物 (V-b) の水酸基を保護して化合物 (V-c) を合成する工程である。保護基 ( $R^{11}$ ,  $R^{21}$ ) の導入のための反応試薬としては、例えば無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物；塩化アセチル、塩化ベンゾイル等の酸塩化物；酢酸、安息香酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸；オルトヒン酸エチル、オルトヒン酸メチル等のオルトエステル類；アセトン、シクロヘキサノン等のケトン類；ベンズアルデヒド、アセトアルデヒド等のアルデヒド類；トリ

50

メチルシリルクロリド、ジメチルフェニルシリルクロリド等のシリル化剤；ジアゾメタン、硫酸ジメチル等のアルキル化剤；ヨウ化メチル、塩化ベンジル等のハロゲン化アルキル類等が用いられる。この反応は、適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トリエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒；メタノール、エタノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水などの単独または混合溶媒中で、-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約 -10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行うことができる。また、この反応には触媒または反応促進剤を使用することもできる。かかる触媒または反応促進剤としては、例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；酢酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸等の有機酸類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物 (V-b) に対して 0.01～10 当量、好ましくは 0.1～1.1 当量の範囲内で使用することができる。

工程 4:

この工程は、化合物 (V-c) を加水分解または接触水素添加して化合物 (V-d) に変換するものである。この反応は溶媒中で適当な触媒を用いて行うことができる。加水分解は、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；水；酢酸、プロピオン酸等の有機酸類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類の単独または混合溶媒中で -78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約 -10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行うことができる。使用できる触媒としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；塩酸、硝酸、硫酸等の鉱酸類；フッ化水素、臭化水素、ヨウ化水素等のハロゲン化水素類；トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸等の有機酸類があげられる。一

(26)

51

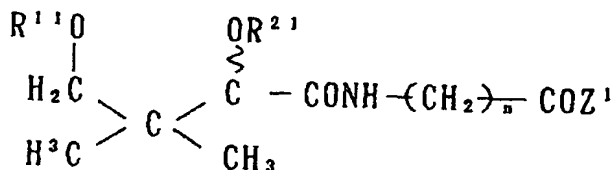
方、触媒水素添加はそれ自体既知の通常の方法で行なうことができ、金属触媒としては、ニッケル、パラジウム、ロジウム、白金等が用いられる。

工程5:

本工程は、化合物(V-d)を化合物(V)に変換する工程である。この反応において用いられる試薬としては、塩化チオニル、オキシ塩化リン、五塩化リン等のハロゲン化試薬類；または、メタノール、エタノール等のアルコール類；p-ニトロフェノール、2,4-ジニトロフェノール等のフェノール類などのエステル化試薬類が用いられる。本工程は、適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；水などの単独または混合溶媒中で、-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行うことができる。また、反応に触媒または反応促進剤を使用することもできる。かかる触媒または反応促進剤としては、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物(V-d)に対して0.01~10当量、好ましくは0.1~1.1当量の範囲内で使用することができる。

工程6:

本工程は、化合物(V-a)から化合物(V-d)を合成する工程である。化合物(V-a)に反応させる試薬としては、無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物；\*



(V)

式中、

$\text{R}^1, \text{R}^2, n$ および $\text{Z}^1$ は前記定義のとおりである、

で示される化合物を下記式



式中、

A, XおよびYは前記定義のとおりである、

で示される化合物とを反応させることにより得られる。

本反応は、適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トルエ

52

\* 塩化アセチル、塩化ベンゾイル等の酸塩化物；酢酸、安息香酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸；オルト蟻酸エチル、オルト蟻酸メチル等のオルトエステル類；アセトン、シクロヘキサノン等のケトン類；ベンズアルデヒド、アセトアルデヒド等のアルデヒド類；トリメチルシリルクロリド、ジメチルフェニルシリルクロリド等のシリル化剤；ジアゾメタン、硫酸ジメチル等のアルキル化剤；ヨウ化メチル、塩化ベンジル等のハロゲン化アルキル類等が用いられる。この反応は、適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；水などの単独または混合溶媒中で、-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約-10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行うことができる。また、この反応には触媒または反応促進剤を使用することもできる。かかる触媒または反応促進剤としては、例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；酢酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸等の有機酸類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物(V-b)に対して0.01~10当量、好ましくは0.1~1.1当量の範囲内で使用することができる。

〔式(II)の化合物の製造〕

化合物(II)は、上記の如くして製造される下記式

ン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；水などの単独または混合溶媒中で、-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約-10℃から使用溶媒の沸

(27)

53

点温度の範囲内の温度で行うことができる。また、反応に触媒または反応促進剤を使用することもできる。かかる触媒または反応促進剤としては、例えばジシクロヘキシルカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；塩化チオニル、オキシ塩化リン、五塩化リン等のハロゲン化試薬類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；酢酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸等の有機酸類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物(V)に対して0.01~10当量、好ましくは0.1~1.1当量の範囲内で使用することができる。

〔式(VI)の化合物の製造〕

化合物(VI)は下記式



式中

A, XおよびYは前記定義のとおりである、

で示される化合物を下記式



式中、

$\text{R}^3$ および $\text{Z}^1$ は前記定義のとおりである、

で示される化合物と反応させることにより得られる。

本反応は、適当な溶媒中、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；エチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の高沸点極性溶媒類；メタノール、エタノール等のアルコール類；水などの単独または混合溶媒中で、-78℃から使用溶媒の沸点温度、好ましくは約-10℃から使用溶媒の沸点温度の範囲内の温度で行うことができる。また、反応に触媒または反応促進剤を使用することもできる。かかる触媒または反応促進剤としては、例えばジシクロヘキシルカルボジイミド、ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)-カ

54

ルボジイミド塩酸塩等のカルボジイミド類；塩化チオニル、オキシ塩化リン、五塩化リン等のハロゲン化試薬類；無水酢酸、無水安息香酸等の酸無水物類；水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基類；トリエチルアミン、ジエチルアミン、ジメチルアミン、ジイソプロピルアミン、ピリジン等の有機塩基類；酢酸、p-トルエンスルホン酸、カンファースルホン酸等の有機酸類があげられる。これら触媒または反応促進剤は、化合物(V)に対して0.01~10当量、好ましくは0.1~1.1当量の範囲内で使用することができる。

本発明により提供される前記式(I)の化合物は、優れたACAT阻害活性を有しており、高脂血症、動脈硬化症、狭心症、心筋梗塞、血栓症等の治療、処理、予防のための薬物として使用することが期待される。

本発明の化合物のACAT阻害活性は以下に述べる試験法により確認することができる。

ACAT阻害性試験は、Helgerudらの方法〔Journal of Lipid Research, 22, 497 (1981) 参照〕及びFolchらの方法〔Journal of Biological Chemistry, 226, 497 (1957) 参照〕に準じ、 $[1-^{14}\text{C}]$ オレオイルCoAと細胞内コレステロールとにより生成するコレステリルオレエートを測定することにより行なった。

即ち、2  $\mu\text{M}$  牛血清アルブミンと2  $\mu\text{M}$   $[1-^{14}\text{C}]$ オレオイル-CoAとを0.514Mリン酸カリウム緩衝液(pH7.4)に溶かした溶液0.5mlに、ラット肝臓より調整したミクロソーム画分(0.3mg蛋白)を0.514Mリン酸カリウム緩衝液(pH7.4)に溶かした溶液10  $\mu\text{l}$ と被験薬 $10^{-7}\text{M}$ をジメチルスルホキシドに溶かした溶液5  $\mu\text{l}$ とを加え、37℃で4分間反応させる。

その後、メタノール4.2ml及びクロロホルム8.3mlを加え反応を停止させ、水2.5mlを加え充分震盪後クロロホルム層を分取した。クロロホルム層を濃縮の後、薄層クロマトグラフィーに供し、生成したコレステリルオレエートを分取し、放射活性を液体シンチレーションカウンターにて測定する。

また、検体を用いることなく、上記と同一試験を行ない得られたコントロールの放射活性を基準として各被験化合物のACAT阻害活性を算出する。

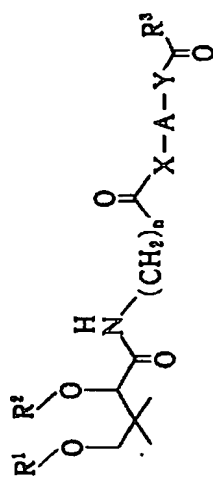
その結果を下記第1表に示す。

(28)

55


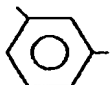
56

第 1 表



下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-4</sup> M [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-1</sup> M]
1	X		2	NH	NH		$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	83.8 [2.95(1.95-4.47)]
2	Ac	Ac	2	NH	NH		$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	84.8 [2.74(1.87-4.02)]
4	X		2	NH	NH		$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	79.8
5	X		2	NH	NH		$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	56.0

(29)








下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-4</sup> H [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-4</sup> H]
15	X	X	2	0	NH		$\begin{array}{c} \text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---CH} \\ \text{CH}_3\text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---CH} \end{array}$	79.6
9	X	X	2	NH	NH		$\begin{array}{c} \text{CH=CH} \\ \text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---} \\ \text{CH}_3\text{---(CH}_2\text{)}_4\text{---CH=CH} \end{array}$	51.8
33	X	X	2	NH	NH	---(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> ---	$\begin{array}{c} \text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---CH} \\ \text{CH}_3\text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---CH} \end{array}$	73.1 [2.99(1.55-5.89)]
34	X	X	2	NH	NH	---(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> ---	$\begin{array}{c} \text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---CH} \\ \text{CH}_3\text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---CH} \end{array}$	85.1 [3.85(2.07-7.16)]
37	X	X	2	NH	NH	---(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> ---	$\begin{array}{c} \text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---CH} \\ \text{CH}_3\text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---CH} \end{array}$	72.6 [2.86(1.44-5.88)]
40	X	X	2	NH	NH	---(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> ---	$\begin{array}{c} \text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---CH} \\ \text{CH}_3\text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---CH} \end{array}$	75.6
41	X	X	2	NH	NH	---(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> ---	$\begin{array}{c} \text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---CH} \\ \text{CH}_3\text{---(CH}_2\text{)}_7\text{---CH} \end{array}$	68.2

57

58



(30)

下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-5</sup> H [C <sub>80</sub> × 10 <sup>-7</sup> H]
42			2	NH	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH=CH- CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	82.0
44			2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH=CH- CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	69.3 [8.88(4.37-10.8)]
45	H	H	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH=CH- CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	51.1
46			2	0		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH=CH- CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	65.6
47			2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH=CH- CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	81.3 [2.50(1.45-4.37)]
48	H	H	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH=CH- CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	58.7
51	PhCO	H	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH=CH- CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	64.9
52	Ph 		2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH=CH- CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	65.5
53			2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH=CH- CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	64.6

60

(31)

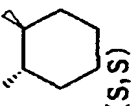
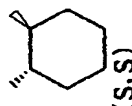
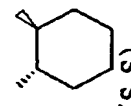
61

下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) $10^{-3} \mu$ [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-7</sup> H]
54	tBuCO	H	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	83.2
58	X		2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>10</sub> -CH <sub>3</sub>	53.2
59	X		2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>13</sub> -CH <sub>3</sub>	54.3
60	X		2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>14</sub> -CH <sub>3</sub>	64.5
61	X		2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>18</sub> -CH <sub>3</sub>	61.6
62	X		2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	$  \begin{array}{c}  \text{CH}=\text{CH} \\  \diagup \quad \diagdown \\  \text{-(CH}_2\text{)}_7 \quad \text{CH}_2 \\  \text{CH}_3\text{-(CH}_2\text{)}_4 \quad \text{CH}=\text{CH}  \end{array}  $	79.0
63	X		2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -(CH=CHCHCl <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>3</sub>	77.5
64	X		2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	81.1 [1.95(1.91-4.17)]
65	H	H	2	0	NH	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH	60.7

62

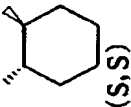
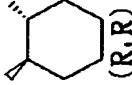
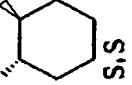
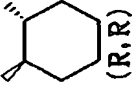
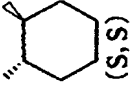
(32)

63

下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) $10^{-5}$ [ $C_{50} \times 10^{-1} M$ ]
66	X	X	2	0	NH	$-(CH_2)_5-$	$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	83.6 [3.55(1.82-7.08)]
67	X	X	2	0	NH	$-(CH_2)_5-$	$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	84.4 [3.89(2.29-6.61)]
68	X	X	2	S	NH	$-(CH_2)_2-$	$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	63.8
69	H	H	2	S	NH	$-(CH_2)_2-$	$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	61.8
70	X	X	2	NH	NH	 (S,S)	$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	85.8 [1.82(0.80-3.29)]
71	Ac	Ac	2	NH	NH	 (S,S)	$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	81.7 [1.98(1.95-4.47)]
74	H	H	2	NH	NH	 (S,S)	$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	87.3 [1.55(1.12-2.14)]

64

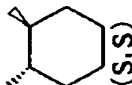
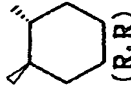
(33)

下記表施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) $10^{-3}H$ [ $[C_{50} \times 10^{-1}H]$
76	Ac (S)	Ac	2	NH	NH	 (S,S)	$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	88.0 [3.60(1.88-6.92)]
77	X	X	2	0	NH	 (R,R)	$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	88.9 [2.1(1.88-2.34)]
78	X	X	2	0	NH	 S,S	$-(CH_2)_7-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	98.9 [0.401(0.29-0.553)]
79	X	X	2	0	NH	 (R,R)	$-(CH_2)_{16}-CH_3$	51.3
80	X	X	2	0	NH	 (S,S)	$CH_3-(CH_2)_4-CH=CH-CH_2-(CH_2)_7-CH=CH-$	93.5 [1.08]

66

65

(34)

下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-5</sup> M [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-7</sup> M]
81	X		2	0	NH	$\begin{array}{c} \text{---CH---CH}_2\text{---} \\   \\ \text{CH}_3 \text{ (R)} \end{array}$	$\text{---(CH}_2\text{)}_6\text{CH=CH(CH}_2\text{)}_7\text{CH}_3$	77.1
82	X		2	0	NH	$\begin{array}{c} \text{---CH---CH}_2\text{---} \\ \equiv \\ \text{CH}_3 \text{ (S)} \end{array}$	$\text{---(CH}_2\text{)}_6\text{CH=CH(CH}_2\text{)}_7\text{CH}_3$	82.4
83	X		2	0	NH	 (S, S)	$\text{---(CH}_2\text{)}_7\text{CH=CH(CH}_2\text{)}_7\text{CH}_3$	95.4
84	X		2	0	NH	 (R, R)	$\text{---(CH}_2\text{)}_7\text{CH=CH(CH}_2\text{)}_7\text{CH}_3$	88.2
85	X		2	0	NH	$\begin{array}{c} \text{CH=CH} \\ / \quad \backslash \\ \text{CH}_2 \quad \text{CH}_3 \\ \text{(Z)} \end{array}$	$\text{---(CH}_2\text{)}_7\text{CH=CH(CH}_2\text{)}_7\text{CH}_3$	77.9
86	X		2	0	NH	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{---CH}_2\text{---CH---} \\   \\ \text{(R)} \end{array}$	$\text{---(CH}_2\text{)}_7\text{CH=CH(CH}_2\text{)}_7\text{CH}_3$	51.5

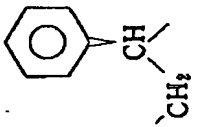
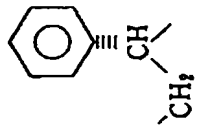

67

68




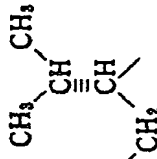

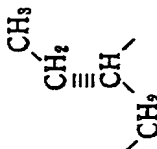

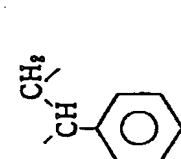

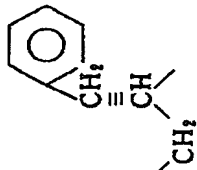
(35)

69

70

下記表施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) $10^{-9}$ M [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-7</sup> M]
87	X		2	0	NH	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \equiv \\ \text{---CH}_2\text{---CH---} \\ \text{(S)} \end{array}$	$\text{---(CH}_2)_7\text{CH=CH(CH}_2)_7\text{CH}_3$	81.3
88	X		2	0	NH	$\begin{array}{c} \text{CH}_3\text{---} \\   \\ \text{CH=CH} \\   \\ \text{---CH}_2\text{---} \end{array} \text{(E)}$	$\text{---(CH}_2)_7\text{CH=CH(CH}_2)_7\text{CH}_3$	81.7
89	X		2	0	NH	$\text{---CH}_2\text{---C}\equiv\text{C---CH}_2\text{---}$	$\text{---(CH}_2)_7\text{CH=CH(CH}_2)_7\text{CH}_3$	88.9
90	X		2	0	NH		$\text{---(CH}_2)_7\text{CH=CH(CH}_2)_7\text{CH}_3$	89.4
91	X		2	0	NH		$\text{---(CH}_2)_7\text{CH=CH(CH}_2)_7\text{CH}_3$	90.6
92	X		2	0	NH		$\text{---(CH}_2)_7\text{CH=CH(CH}_2)_7\text{CH}_3$	86.4



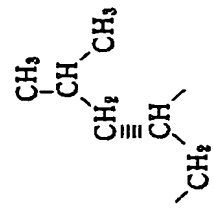


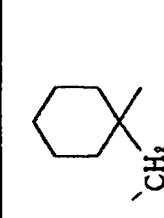


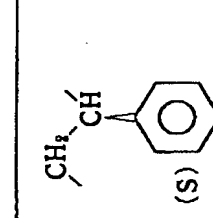


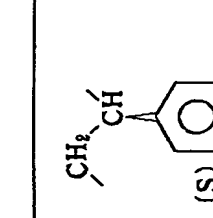
(36)

下配實施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-6</sup> H [C <sub>50</sub> × 10 <sup>-7</sup> H]
93		2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	95.3
94		2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	94.3
95		2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	90.0
96		2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	88.4
97		2	0	NH		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH=CH(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	84.2

71

72

(37)


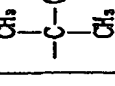
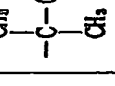
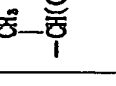
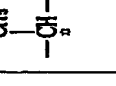
下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-6</sup> M [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-7</sup> M]
98			2	0	NH		$-(CH_2)_7CH=CH(CH_2)_7CH_3$	89.1
99			2	0	NH		$-(CH_2)_7CH=CH(CH_2)_7CH_3$	65.8
100			1	0	NH		$-(CH_2)_7CH=CH(CH_2)_7CH_3$	90.0
101			3	0	NH		$-(CH_2)_7CH=CH(CH_2)_7CH_3$	84.6

73

74



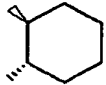
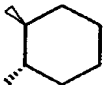
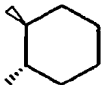
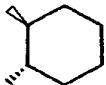
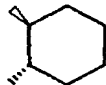
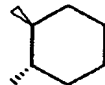
(38)

下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-6</sup> H [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-7</sup> H]
102	X		4	0	NH		$-(CH_2)_7CH=CH(CH_2)_7CH_3$	84.3
103	X		2	0	NH		$CH_3-C(CH_3)_2-(CH_2)_{18}-CH_3$	63.9
104	X		2	0	NH		$CH_3-C(CH_3)_2-(CH_2)_6CH=CH(CH_2)_7CH_3$	94.2
105	X		2	0	NH		$CH_3-CH(CH_3)_2CH=CH(CH_2)_7CH_3$	95.6
106	X		2	0	NH		$CH_3-CH(CH_3)_2-(CH_2)_{18}-CH_3$	91.5

75

76

(39)

下記實施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-6</sup> M [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-1</sup> M]
107	X	X	2	0	NH		$\text{CH}_3$   $-\text{CH}-(\text{CH}_2)_{13}-\text{CH}_3$	92.9
108	X	X	2	0	NH		$\text{CH}_2\text{CH}_3$   $-\text{CH}-(\text{CH}_2)_{11}-\text{CH}_3$	93.6
109	X	X	2	0	NH		$\text{CH}_2\text{CH}_3$   $-\text{CH}-(\text{CH}_2)_{11}-\text{CH}_3$	93.3
110	X	X	2	0	NH		$(\text{CH}_3)_3-\text{CH}_2$   $-\text{CH}-(\text{CH}_2)_{16}-\text{CH}_3$	68.3
111	X	X	2	0	NH		$(\text{CH}_3)_3-\text{CH}_2$   $-\text{CH}-(\text{CH}_2)_{18}-\text{CH}_3$	58.3
112	X	X	2	0	NH		$\text{CH}_2-\text{CH}_2$   $\text{CH}_2-\text{C}-\text{CH}_2$   $(\text{CH}_2)_{11}-\text{CH}_3$	95.4

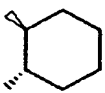
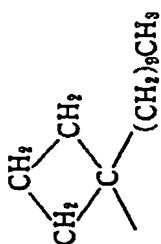
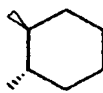
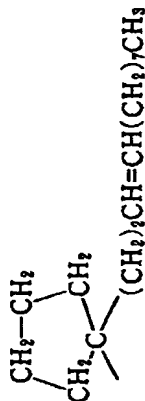
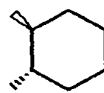

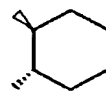
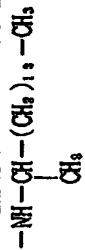
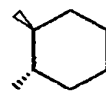
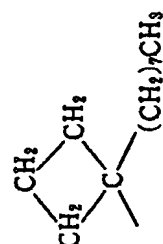
77

78

(40)

79

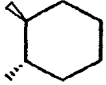
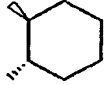
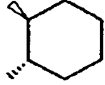
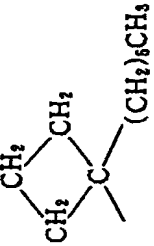
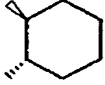
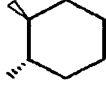
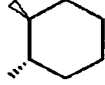
80

下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-6</sup> M [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-4</sup> M]
113	X	X	2	0	NH			98.1
114	X	X	2	0	NH			84.2
115	X	X	2	0	NH			95.1
116	X	X	2	0	NH			92.7
117	X	X	2	0	NH			78.0

79

80


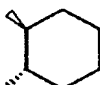



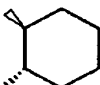
(41)

下記表施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-6</sup> M [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-7</sup> M]
118	X		2	0	NH		$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ -CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>9</sub> -CH <sub>3</sub>	88.2
119	X		2	0	NH		$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ -CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>9</sub> -CH <sub>3</sub>	76.0
120	X		2	0	NH			41.0
123	X		2	0	NH		$\text{CH}_3$ -CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>9</sub> -CH <sub>3</sub>	94.1
124	X		2	0	NH		$\text{CH}_3$ -CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>9</sub> -CH <sub>3</sub>	87.7
126	X		2	0	NH		$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ -N-(CH <sub>2</sub> ) <sub>9</sub> -CH <sub>3</sub>	88.2

81

82

(42)

下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) $10^{-6}$ M [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-1</sup> M]
127	X		2	0	NH		$\text{CH}_3-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{N}-(\text{CH}_2)_6-\text{CH}_3$	95.8
128	X		2	0	NH		$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}-(\text{CH}_2)_5-\text{CH}_3$	81.8
129	X		2	0	NH		$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}-(\text{CH}_2)_5-\text{CH}_3$	87.5
130	X		2	0	NH		$\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}-(\text{CH}_2)_6-\text{CH}_3$	91.9
131	X		2	0	NH		$\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}-(\text{CH}_2)_6-\text{CH}_3$	87.6
134	X		2	0	NH		$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}-(\text{CH}_2)_6-\text{CH}_3$	95.1

83

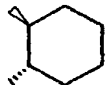
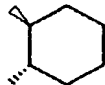
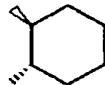
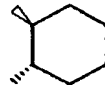
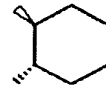
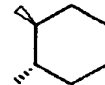
84

(43)

下配表施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-6</sup> M [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-1</sup> M]
135	X		2	0	NH		$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_5$   -CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> CH <sub>3</sub>	93.9
136	X		2	0	NH		$(\text{CH}_2)_3$   C   CH <sub>2</sub> -CH=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	59.7
137	X		2	0	NH		$(\text{CH}_2)_3$   C   (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	63.5
138	X		2	0	NH		$\text{C}_6\text{H}_5$   C-(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -CH <sub>3</sub>   $\text{C}_6\text{H}_5$	88.3
139	H	H	2	0	NH		$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_5$   -CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>3</sub>	63.9

86

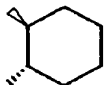
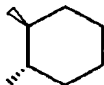
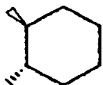
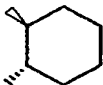
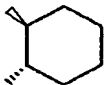
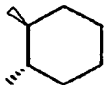
(44)

下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) $10^{-6} \mu$ [ $C_{50} \times 10^{-7} \mu$ ]
140	X		2	0	NH		$\begin{array}{c} \text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5 \\   \\ -\text{N}-(\text{CH}_2)_5-\text{CH}_3 \end{array}$	84.4
141	X		2	0	NH		$\begin{array}{c} \text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5 \\   \\ -\text{N}-(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3 \end{array}$	89.9
142	X		2	0	NH		$\begin{array}{c} \text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5 \\   \\ -\text{N}-(\text{CH}_2)_9-\text{CH}_3 \end{array}$	87.9
143	X		2	0	NH		$\begin{array}{c} \text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5 \\   \\ -\text{CH}-(\text{CH}_2)_9-\text{CH}_3 \end{array}$	82.2
144	X		2	0	NH		$\begin{array}{c} \text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5 \\   \\ -\text{CH}-(\text{CH}_2)_6-\text{CH}_3 \end{array}$	80.0
145	X		2	0	NH		$\begin{array}{c} (\text{CH}_2)_6\text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH}=\text{C}- \\   \\ (\text{CH}_2)_6\text{CH}_3 \end{array}$	89.0

88

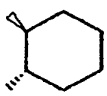
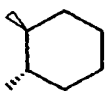
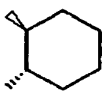
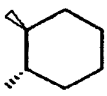
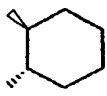
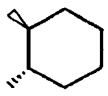
87

(45)

下記実施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-6</sup> M [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-7</sup> M]
146	X		2	0	NH		$\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5$ $\text{CH}_2-\text{C}_6\text{H}_5$	77.6
147	X		2	0	NH		$(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$ $(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	88.1
150	X		2	0	NH		$(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$ $(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	97.3
151	X		2	0	NH		$(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$ $(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	97.7
152	X		2	0	NH		$(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$ $(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	97.3
153	X		2	0	NH		$(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$ $(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$	97.5



(46)

下記表施 例番号の 化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-6</sup> M [IC <sub>50</sub> × 10 <sup>-7</sup> M]
154	X		2	0	NH		$(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$ -C=C H C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	91.6
155	X		2	0	NH		$(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$ -C=CH (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	92.5
156	X		2	0	NH		$(\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$ -C=CH (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	96.3
157	X		2	0	NH		$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_5$ -N- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	97.3
158	X		1	0	NH		$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_5$ -CH- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	97.8
159	X		2	0	NH		$(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$ -CH- (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	96.2

(47)

下記実施例の化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	n	X	Y	A	R <sup>3</sup>	ACAT 抑制率(%) 10 <sup>-6</sup> H [1C <sub>50</sub> × 10 <sup>-1</sup> H]
160	X	X	2	0	NH		$(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$ -NH-CH- $(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$	98.9
161	X	X	2	0	NH		$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_5$ -CH- $\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_5$	64.3
162	X	X	2	0	NH		$(\text{CH}_2)_4-\text{C}_6\text{H}_5$ -CH- $(\text{CH}_2)_4-\text{C}_6\text{H}_5$	97.1
163	X	X	2	0	NH		$(\text{CH}_2)_4-\text{C}_6\text{H}_5$ -CH- $(\text{CH}_2)_4-\text{C}_6\text{H}_5$	98.1
164	X	X	2	0	NH		$\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(\text{CH}_3)_2$ -CH- $\text{CH}_3-\text{C}_6\text{H}_4-\text{C}(\text{CH}_3)_2$	94.6

上記表中、  
  
 =CH<sub>3</sub>, Ac=CH<sub>3</sub>CO, Ph=フェニル

本発明の化合物を薬物として高脂血症、動脈硬化症、狭心症、心筋梗塞、血栓症等の病気の治療、処置、予防等に使用する場合、該化合物は製薬助剤、例えば製薬学的に許容しうる担体、希釈剤、賦形剤、結合剤、崩解剤、潤滑剤、防腐剤、安定化剤、溶解助剤、香味剤等と共に、投与に適した剤形、例えば錠剤、カプセル剤、散剤、顆粒剤、マイクロカプセル剤、シロップ剤、エリキシル剤、注射剤、坐剤等の単位投与形態に製剤化することができる。

これら製剤における有効成分の含有量は、本発明の化合物の種類、製剤のタイプ、使用目的等に応じて広い範

40 囲で変えることができるが、一般には0.5~90重量%、好ましくは5~60重量%の範囲内とすることができる。

錠剤、カプセル剤、散剤、顆粒剤等の固体の調製物においては、本発明の化合物を、乳糖、マンニトール、ブドウ糖、ヒドロキシプロピルセルロース、微結晶セルロース、カルボキメチルセルロース、デンプン、ポリビニルピロリドン、メタケイ酸アルミニウム、タルク糖の担体又は希釈剤；ステアリン酸マグネシウム等の潤滑剤；繊維素グルコン酸カルシウム等の崩解剤；グルタミン酸、アスパラギン酸等の溶解助剤；ラクトース等の安定化剤と共に常法に従って製剤化することができる。ま

(48)

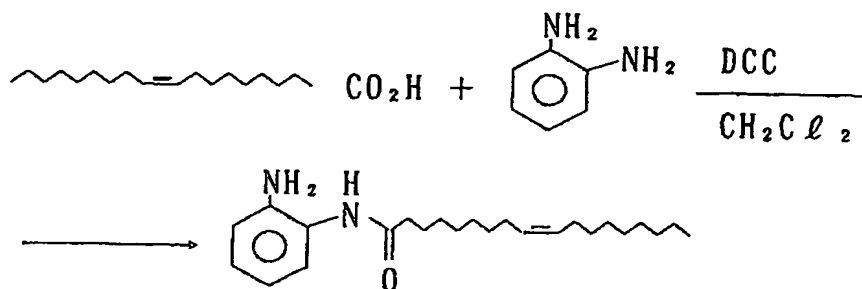
95

た、錠剤には必要により、白糖、ゼラチン、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース等の胃溶性又は腸溶性物質でコーティングを施してもよく、カプセル剤はハードカプセル剤としてもよく、またソフトカプセル剤にしてもよい。

シロップ剤、エリキシル剤、溶液剤、乳濁剤、懸濁剤等の液状の調製物の場合には、本発明の化合物を製薬学的に許容しうる液体媒体、例えば精製水、生理食塩水、緩衝液、エタノール等に溶解ないし分散させ、さらに必要に応じて、界面活性剤、甘味剤、風味剤、芳香剤、防腐剤等を適宜配合することにより製剤化することができる。

他方、非経口投与のための注射剤としては、無菌の水溶性又は非水溶性の溶液、懸濁液及び乳濁液が含まれる。そのような注射剤は、本発明の化合物を注射用蒸留水、生理食塩水等の水性希釈剤又はポリエチレングリコール、プロピレングリコール、オリーブ油、エタノール、ポリソルベート80（登録商標）等の非水性希釈剤と混合することにより調製することができる。さらに、注射剤には必要に応じて、防腐剤、湿潤剤、界面活性剤、分散剤、\* 20

### o-オレオイルアミノアニリン



オレイン酸2.82gとo-フェニレンジアミン1.62gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド2.27gを加え、室温で一晩攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.84g（収率76%）を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>NH</sub>3284, ν<sub>CO</sub>1646

質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>40</sub>N<sub>2</sub>O

\* 安定化剤、溶解助剤等の助剤を含ませることもできる。

これらの注射剤は通常、バクテリア保留フィルター等を用いて濾過、殺菌剤の配合又は照射等により無菌化することができ、さらにこれらの処理をしたのち、凍結乾燥等の方法により固体調製物とした使用直前に無菌水又は無菌の注射用希釈剤を加えて使用することもできる。

本発明の化合物は、経口投与又は直腸投与により或いは静脈内、筋肉内、皮下等の非経口投与によって投与することができる。その投与量は、用いる化合物の種類、投与の方法、処理すべき患者の症状の軽重、患者の年齢や体重、医師の判断等に応じて変えることができるが、一般には、1日当たり約2～約500mg/kg体重を1日1回又は2～4回に分割投与するのが適当である。しかし、上記投与量範囲はあくまでも一応の目安であり、医師の判断、症状の軽重等に応じて、上記範囲以上又は以下の量を投与することも勿論可能である。

以下、実施例により本発明をさらに具体的に説明する。

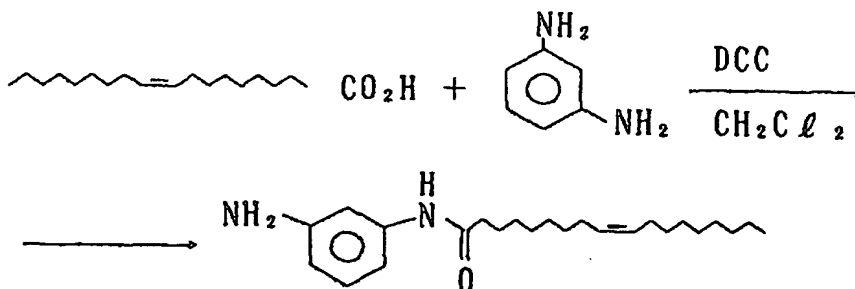
#### 参考例-1

理論値 372.3140

実測値 372.3129

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
1.18-1.45 (20H, m) 、 1.65-1.81 (2H, m) 、  
1.90-2.09 (4H, m) 、 2.41 (2H, t, J=7Hz) 、  
3.84 (2H, brs) 、 5.28-5.43 (2H, m) 、  
6.76-6.83 (2H, m) 、 7.02-7.13 (2H, m) 、  
7.17 (1H, d, J=8Hz)

40 2-m-オレオイルアミノアニリン



(49)

97

オレイン酸2.82gとm-フェニレンジアミン1.62gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド2.27gを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.60g (収率70%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>NH</sub>3324, ν<sub>C</sub>1658

質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>40</sub>N<sub>2</sub>O

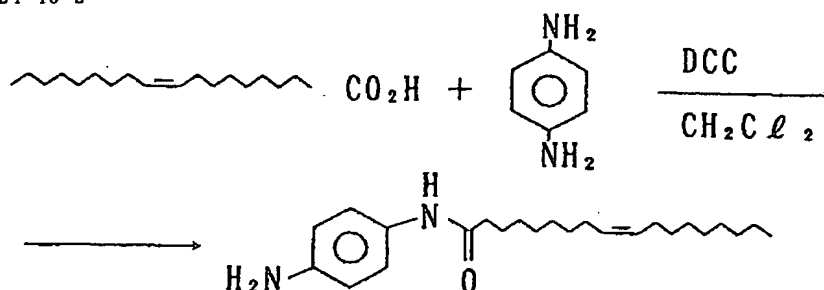
\* 理論値 372.3140

実測値 372.3143

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
1.20-1.42 (20H, m) 、 1.64-1.78 (2H, m) 、  
1.90-2.09 (4H, m) 、 2.32 (2H, t, J=7Hz) 、  
3.70 (2H, brs) 、 5.29-5.40 (2H, m) 、  
6.42 (1H, d, J=8Hz) 、 6.62 (1H, d, J=8Hz) 、  
7.00 (1H, brs) 、 7.21 (1H, s)

3 p-オレオイルアミノアニリン

\* 10



オレイン酸2.82gとp-フェニレンジアミン1.62gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド2.27gを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.85g (収率77%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>NH</sub>3294, ν<sub>C</sub>1656

質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>40</sub>N<sub>2</sub>O

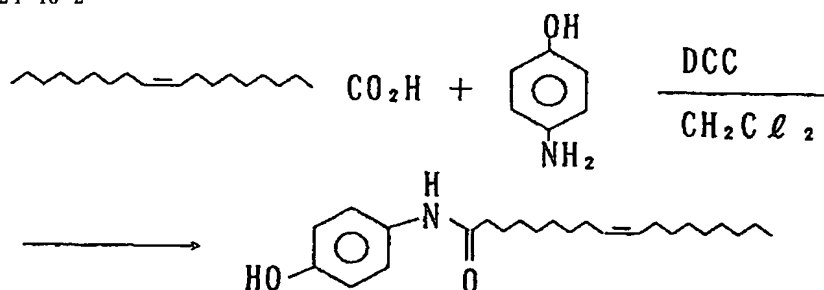
20※ 理論値 372.3140

実測値 372.3138

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
1.18-1.42 (20H, m) 、 1.64-1.77 (2H, m) 、  
1.92-2.09 (4H, m) 、 2.31 (2H, t, J=7Hz) 、  
3.60 (2H, brs) 、 5.29-5.40 (2H, m) 、  
6.65 (2H, d, J=9Hz) 、 6.92 (1H, brs) 、  
7.26 (2H, d, J=9Hz)

4 p-オレオイルアミノフェノール

※



オレイン酸2.82gとp-アミノフェノール1.64gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド2.27gを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物1.57g (収率42%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>NH</sub>, ν<sub>C</sub>1646

質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>39</sub>NO<sub>2</sub>

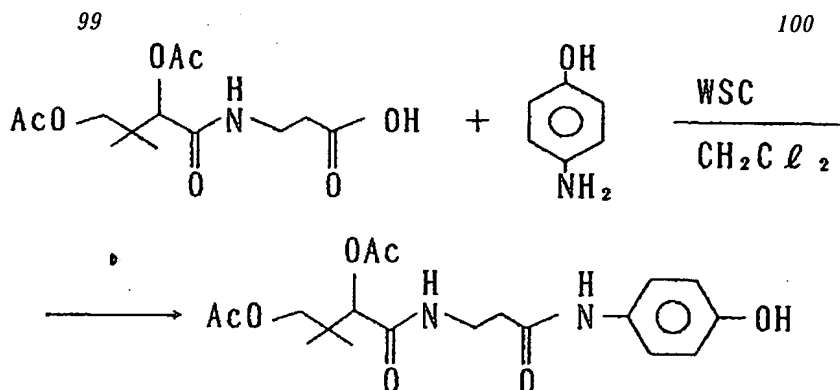
理論値 373.2980

実測値 373.2988

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
1.20-1.42 (20H, m) 、 1.65-1.79 (2H, m) 、  
1.89-2.09 (4H, m) 、 2.31 (2H, t, J=7Hz) 、  
5.28-5.41 (2H, m) 、 6.77 (2H, d, J=9Hz) 、  
7.04 (1H, brs) 、 7.32 (2H, d, J=9Hz)

5 2,4-ジアセトキシ-N-[3-[(4-ヒドロキシフェニル)アミノ]-3-オキソプロピル]-3,3-ジシメチルブタンアミド

(50)



3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオン酸3.03gとp-アミノフェノール2.18gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド2.30gを添加し、室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物1.92g(収率50%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub>1750, 1660

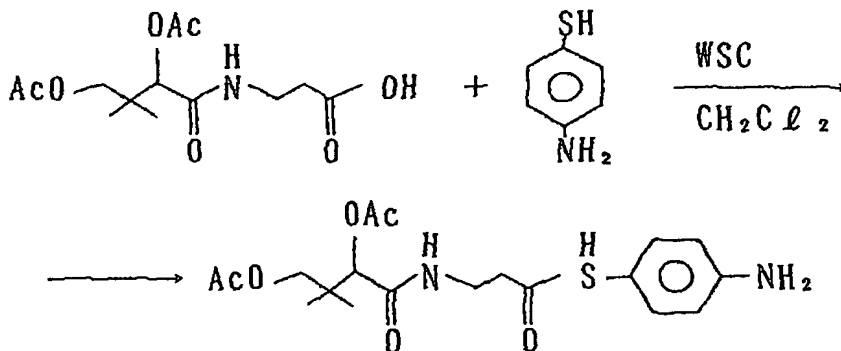
質量分析 分子式；C<sub>19</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>7</sub>

\* 理論値 394.1740

実測値 394.1746

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 1.02 (3H, s)、1.06 (3H, s)、2.05 (3H, s)、2.07 (3H, s)、2.55 (2H, t, J=6Hz)、3.55-3.71 (2H, m)、3.84 (1H, d, J=12Hz)、4.03 (1H, d, J=12Hz)、4.90 (1H, s)、6.74-6.83 (1H, m)、6.79 (2H, d, J=8Hz)、7.35 (2H, d, J=8Hz)、7.47 (1H, brs)

20 6 S-(4-アミノフェニル)3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンチオネート



3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオン酸1.52gとp-アミノチオフェノール1.00gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド2.30gを添加し、室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.335g(収率16%)を得た。

性状；油状

質量分析 分子式；C<sub>19</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>S

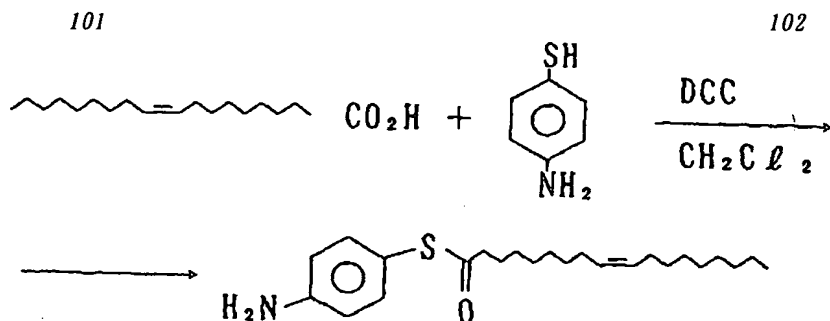
理論値 410.1511

実測値 410.1520

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 1.01 (3H, s)、1.06 (3H, s)、2.06 (3H, s)、2.11 (3H, s)、2.87 (2H, t, J=6Hz)、3.44-3.69 (2H, m)、3.81 (1H, d, J=11Hz)、4.03 (1H, d, J=11Hz)、4.97 (1H, s)、6.50 (1H, t, J=6Hz)、6.92 (2H, d, J=8Hz)、7.24 (2H, d, J=8Hz)

7 S-(4-アミノフェニル)9-オクタデセンチオエート

(51)



オレイン酸2.82gとp-アミノチオフェノール1.88gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド2.27gを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.86g (収率74%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>NH</sub>3500, ν<sub>C=O</sub>1698

質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>39</sub>NOS

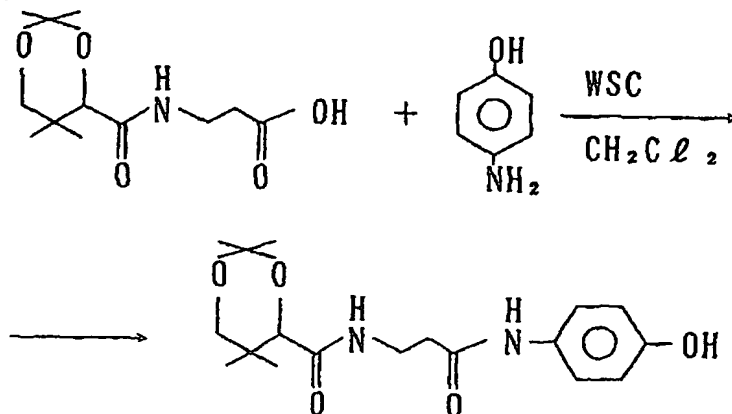
10 \* 理論値 389.2752

実測値 389.2754

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
1.19-1.41 (20H, m) 、 1.62-1.75 (2H, m) 、  
1.91-2.09 (4H, m) 、 2.60 (2H, t, J=7Hz) 、  
3.83 (2H, brs) 、 5.29-5.41 (2H, m) 、  
6.68 (2H, d, J=8Hz) 、 7.16 (2H, d, J=8Hz)

8 N-(4-ヒドロキシフェニル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

\* 9 S-(4-アミノフェニル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンチオアート



3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸1.04gとp-アミノフェノール0.665gとを塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷攪拌下に、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド0.96gを添加し、室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物1.37g (収率98%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub>1660

質量分析 分子式；C<sub>18</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>

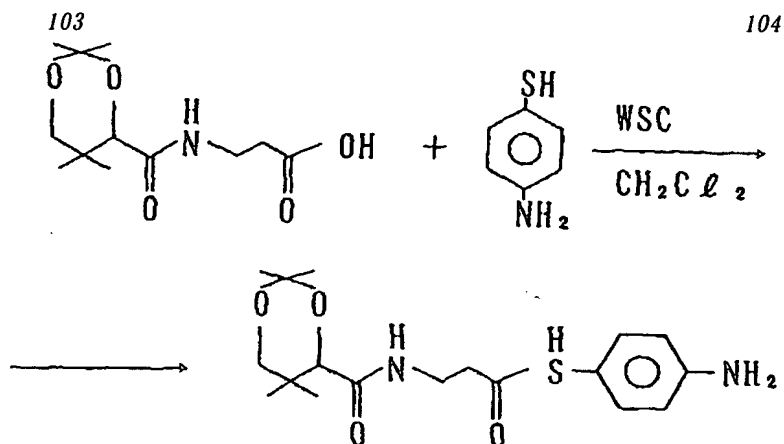
理論値 350.1841

実測値 350.1846

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.97 (3H, s) 、 1.04 (3H, s) 、 1.41 (3H, s) 、 1.45 (3H, s) 、 2.26 (2H, t, J=6Hz) 、 3.50-3.72 (2H, m) 、 3.28 (1H, d, J=12Hz) 、 3.68 (1H, d, J=12Hz) 、 4.10 (1H, s) 、 6.78 (2H, d, J=8Hz) 、 7.13 (1H, t, J=6Hz) 、 7.32 (2H, d, J=8Hz) 、 8.02 (1H, S)

40 9 S-(4-アミノフェニル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンチオアート

(52)



3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオン酸1.30gとp-アミノチオフェノール1.00gとを塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷攪拌下に、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド0.96gを添加し、室温で一晩攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub>1692

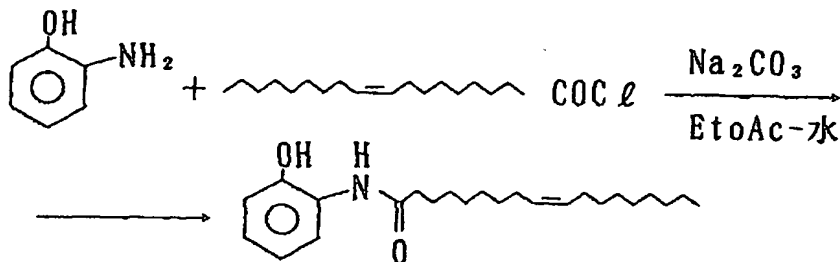
\* 質量分析 分子式；C<sub>18</sub>H<sub>26</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>S

理論値 366.1613

実測値 366.1608

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 1.00 (3H, s)、1.04 (3H, s)、1.42 (3H, s)、1.45 (3H, s)、2.78-2.97 (2H, m)、3.29 (1H, d, J=11Hz)、3.45-3.71 (2H, m)、3.69 (1H, d, J=11Hz)、4.08 (1H, s)、6.69 (2H, d, J=8Hz)、6.84-6.92 (1H, m)、7.15 (2H, d, J=8Hz)

10 o-オレオイルアミノフェノール



2-アミノフェノール1.09gを酢酸エチル20mlと水20mlとの混合溶媒に溶かし炭酸ナトリウム1.27gを添加し氷冷攪拌下に、オレイン酸クロリド3.01gを酢酸エチル10mlに溶かした溶液を滴下し、そのまま2時間攪拌した。反応終了後、有機層を分取し、有機層を水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.40g (収率91%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub>1646

質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>39</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>

理論値 373.2980

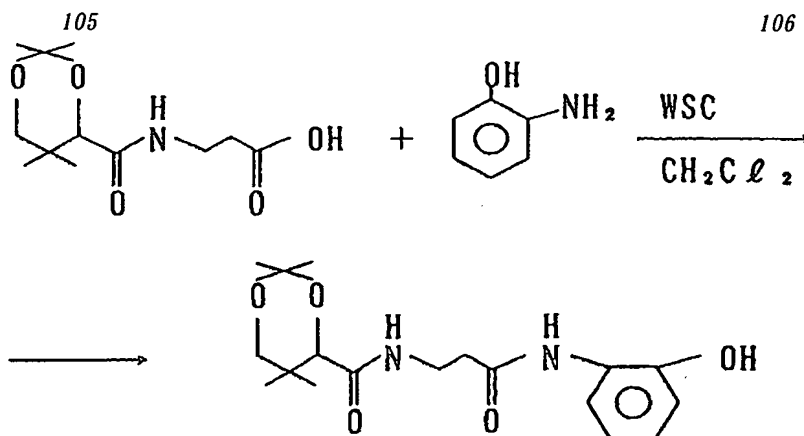
実測値 373.2988

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz)、1.18-1.45 (20H, m)、1.66-1.80 (2H, m)、1.92-2.10 (4H, m)、2.45 (2H, t, J=7Hz)、5.28-5.40 (2H, m)、6.85 (2H, d, J=8Hz)、6.97 (1H, d, J=8Hz)、7.02 (1H, d, J=8Hz)、7.13 (2H, t, J=8Hz)、7.45 (1H, brs)

11 N-(2-ヒドロキシフェニル)-3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロパンアミド

(53)

106



3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸0.26gとo-アミノフェノール0.13gとを塩化メチレン10mlに溶かし、氷冷攪拌下に、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド0.20gを添加し、室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.34g(収率98%)を得た。

性状：油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C=O}}$  1660

質量分析 分子式； $C_{18}H_{26}N_2O_5$

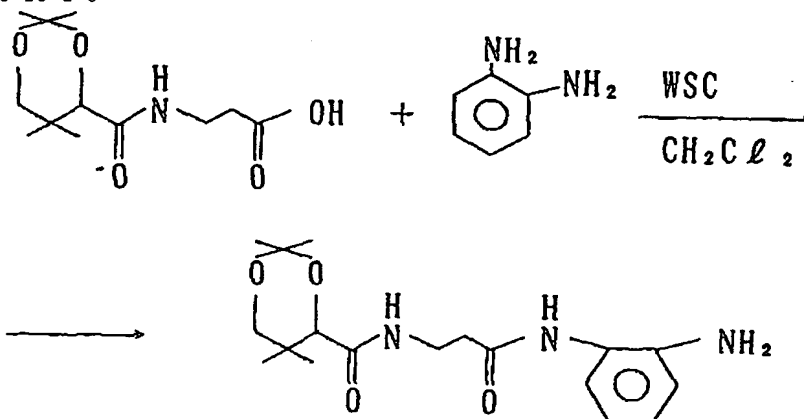
\* 理論値 350.1841

実測値 350.1843

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) ; 0.97 (3H, s) 、 1.03 (3H, s) 、 1.42 (3H, s) 、 1.46 (3H, s) 、 2.77 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) 、 3.28 (2H,  $J=12\text{Hz}$ ) 、 3.59-3.77 (2H, m) 、 4.11 (1H, s) 、 6.86 (1H, t,  $J=8\text{Hz}$ ) 、 7.01 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) 、 7.08-7.22 (3H, m) 、 8.80 (1H, s)

12 N-(2-アミノフェニル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサソ-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

\*



3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ  
ン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸3.89gと  
オーフェニレンジアミン2.16gとを塩化メチレン50mlに溶  
かし、氷冷攪拌下に、塩酸 1-エチル-3-(3-ジ  
メチルアミノプロピル)カルボジイミド2.88gを添加  
し、室温で一晩攪拌した。反応終了後、反応液を水洗  
し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得  
られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに  
供し精製し、標記化合物2.48g(収率47%)を得た。

性状：油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C=O}}$  1660

質量分析 分子式;  $C_{18}H_{27}N_3O_4$

理論値 349.2001

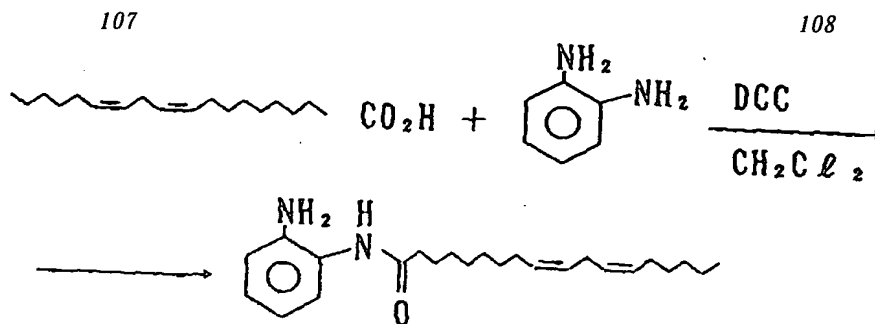
実測値 349.1993

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) : 0.99 (3H, s) 、 1.03 (3H, s) 、 1.42 (3H, s) 、 1.46 (3H, s) 、 2.67 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ ) 、 3.59–3.70 (2H, m) 、 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) 、 3.68 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ) 、 4.10 (1H, s) 、 6.72–6.82 (2H, m) 、 7.03–7.16 (2H, m) 、 7.20 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ) 、 7.87 (1H, s)

13 m-リノレイルアミノアニリン



(54)



リノール酸0.841gとo-フェニレンジアミン0.541gとを塩化メチレン50mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド1.03gを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を除去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.796g (収率72%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub>1646

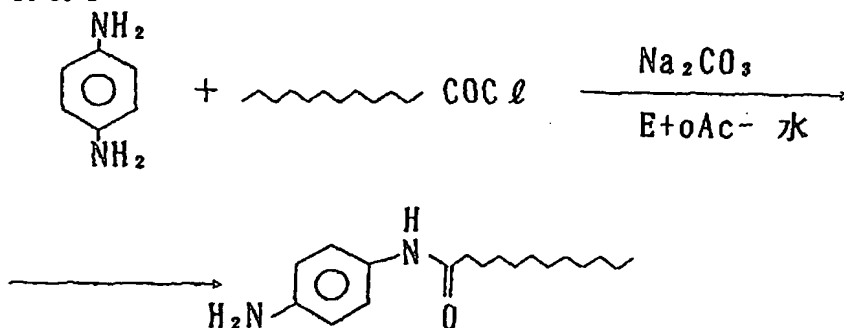
質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>38</sub>N<sub>2</sub>O

10 \* 理論値 370.2984

実測値 370.2981

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.89 (3H, t, J=7Hz) ,  
1.22-1.43 (14H, m) , 1.63-1.88 (2H, m) ,  
1.98-2.11 (4H, m) , 2.32 (2H, t, J=7Hz) ,  
2.77 (2H, t, J=6Hz) , 5.28-5.46 (4H, m) ,  
6.47 (1H, d, J=8Hz) , 6.69 (1H, d, J=8Hz) ,  
7.07 (1H, t, J=8Hz) , 7.14 (1H, s) , 7.24 (2H, s)

\* 14 p-ラウロイルアミノアニリン



p-フェニレンジアミン342mgを酢酸エチル10mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし炭酸ナトリウム106mgを添加し氷冷攪拌下に、ラウリン酸クロリド219mgを酢酸エチル10mlに溶かした溶液を滴下し、そのまま2時間攪拌した。反応終了後、有機層を分取し、有機層を水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物250g (収率86%)を得た。

性状；油状

30 \* IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub>1651

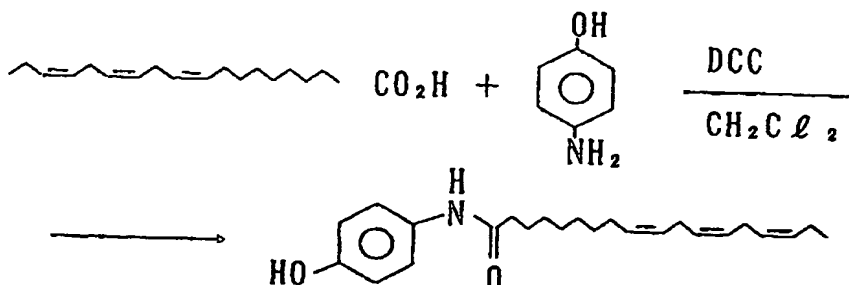
質量分析 分子式；C<sub>18</sub>H<sub>30</sub>N<sub>2</sub>O

理論値 290.2358

実測値 290.2362

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
1.17-1.42 (16H, m) , 1.63-1.78 (2H, m) ,  
2.31 (2H, t, J=7Hz) , 3.581 (2H, brs) ,  
6.64 (2H, d, J=9Hz) , 6.98 (1H, brs) , 7.26 (2H, d, J=9Hz)

\* 15 p-リノレノイルアミノフェノール



リノレン酸835mgとp-アミノフェノール546mgとを塩化メチレン10mlに溶かし、氷冷攪拌下に、N,N'-ジシ

50

クロヘキシルカルボジイミド618mgを加え、室温で一夜攪拌した。反応終了後、不溶物を濾過し、溶媒を留去

(55)

109

し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物1.03g (収率55%) を得た。

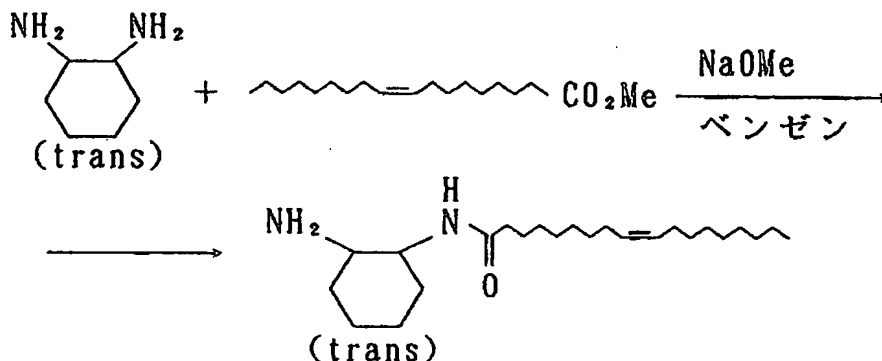
性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C=O}}$  1646

質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>35</sub>N<sub>2</sub>O

理論値 369.2667

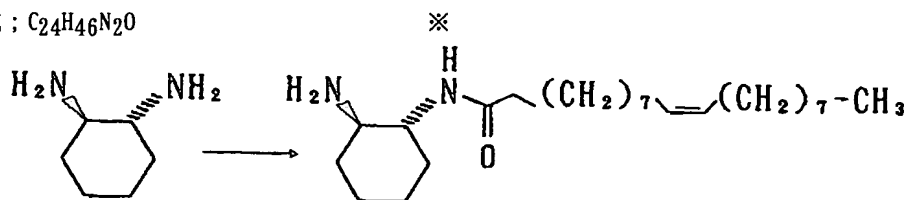
実測値 369.2672



trans-1,2-ジアミノシクロヘキサン1.14gとオレイン酸メチル2.96gとをベンゼン15mlに溶かし、ナトリウムメトキシド0.60gを添加し、20時間加熱還流した。反応終了後、溶媒を減圧下で留去し、残留物を酢酸エチルと水に溶かし有機層を分取した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.54g (収率68%) を得た。

性状；油状

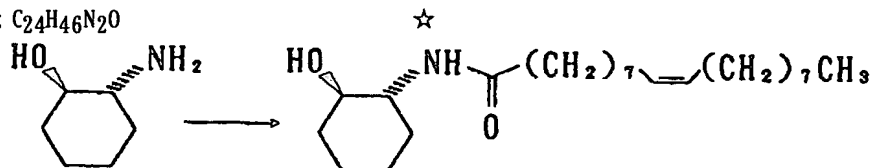
質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>46</sub>N<sub>2</sub>O



(S,S)-1,2-ジアミノシクロヘキサン1.14gとオレイン酸メチル2.96gとをベンゼン15mlに溶かし、ナトリウムメトキシド0.60gを添加し、20時間加熱還流した。反応終了後、溶媒を減圧下で留去し、残留物を酢酸エチルと水に溶かし有機層を分取した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.41g (収率65%) を得た。

性状；油状

質量分析 分子式；C<sub>24</sub>H<sub>46</sub>N<sub>2</sub>O



(1R,2R)-2-アミノシクロヘキサノール1.15gを酢酸エチル10ml及び水10mlに溶かし氷冷撹拌下に、オレ

110

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.97 (3H, t, J=7Hz) 、  
1.19-1.44 (8H, m) 、1.56-1.77 (2H, m) 、  
1.98-2.12 (4H, m) 、2.33 (2H, t, J=7Hz) 、  
2.71-2.88 (4H, m) 、5.26-5.45 (6H, m) 、  
6.77 (2H, d, J=9Hz) 、7.05 (1H, s) 、7.31  
(2H, d, J=9Hz)

16 trans-2-(オレオイレアミノ)シクロヘキシルアミン

20※ 理論値 378.3610  
実測値 378.3611

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
1.12-1.48 (24H, m) 、1.53-1.79 (4H, m) 、  
1.91 (6H, m) 、2.18-2.35 (2H, m) 、2.52-  
2.95 (3H, m) 、3.62-3.78 (1H, m) 、5.28-  
5.40 (2H, m) 、6.08-6.20 (1H, m)

17 (1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキシルアミン

☆ 理論値 378.3610  
実測値 378.3612

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
1.12-1.48 (24H, m) 、1.53-1.79 (4H, m) 、  
1.19 (6H, m) 、2.18-2.35 (2H, m) 、2.52-  
2.95 (3H, m) 、3.62-3.78 (1H, m) 、5.28-  
5.40 (2H, m) 、6.08-6.20 (1H, m)

18 (1R,2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサノール

ン酸クロリド3.0gを酢酸エチル20mlに溶かした溶液を滴下し、滴下終了後3時間撹拌した。反応終了後、水層を

(56)

111

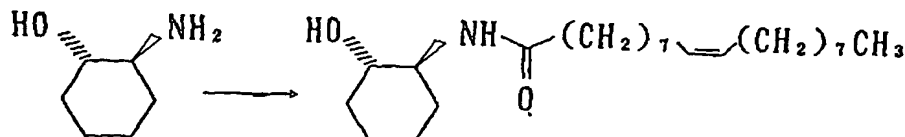
除去し、有機層食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.74g (収率99%)を得た。

性状；油状

質量分析 分子式； $C_{24}H_{45}NO_2$

理論値 379.3450

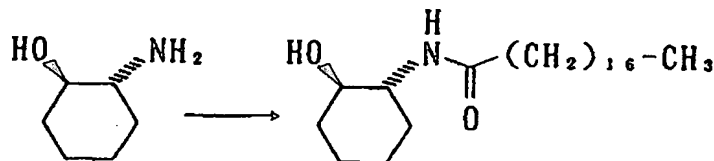
実測値 379.3453



(1S,2S) - 2 - アミノシクロヘキサノール1.15gを酢酸エチル10ml及び水10mlに溶かし氷冷攪拌下に、オレイン酸クロリド3.0gを酢酸エチル20mlに溶かした溶液を滴下し、滴下終了後3時間攪拌した。反応終了後、水層を除去し、有機層を食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.76g (収率99%)を得た。

性状；油状

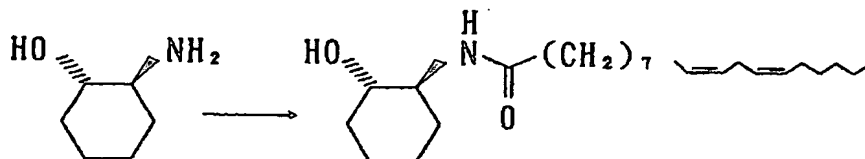
質量分析 分子式； $C_{24}H_{45}NO_2$



(1R,2R) - 2 - アミノシクロヘキサノール1.15gを酢酸エチル10ml及び水10mlに溶かし氷冷攪拌下に、ステアリン酸クロリド3.02gを酢酸エチル20mlに溶かした溶液を滴下し、滴下終了後3時間攪拌した。反応終了後、水層を除去し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.0g (収率100%)を得た。

性状；油状

質量分析 分子式； $C_{24}H_{47}NO_2$



(1S,2S) - 2 - アミノシクロヘキサノール1.15gを酢酸エチル10ml及び水10mlに溶かし氷冷攪拌下に、リノール酸クロリド2.98gを酢酸エチル20mlに溶かした溶液を滴下し、滴下終了後3時間攪拌した。反応終了後、水層を除去し、有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記

\* NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7$ Hz) 、

1.10-1.42 (24H, m) 、 1.57-1.78 (4H, m) 、

1.89-2.10 (6H, m) 、 2.22 (2H, t,  $J=7$ Hz) 、

3.32 (1H, ddd,  $J=11$ Hz, 11Hz, 5Hz) 、 3.58-

3.70 (1H, m) 、 5.28-5.50 (3H, m)

19 (1S, 2S) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロヘキサノール

※ 理論値 379.3450

実測値 379.3453

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7$ Hz) 、

1.10-1.42 (24H, m) 、 1.57-1.78 (4H, m) 、

1.89-2.10 (6H, m) 、 2.22 (2H, t,  $J=7$ Hz) 、

3.32 (1H, ddd,  $J=11$ Hz, 11Hz, 5Hz) 、 3.58-

3.70 (1H, m) 、 5.28-5.50 (3H, m)

20 (1R, 2R) - 2 - (ステアロイルアミノ) シクロヘキサノール

☆ 理論値 381.3606

30 実測値 381.3611

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ) ; 0.88 (3H, t,  $J=7$ Hz) 、

1.11-1.41 (32H, m) 、 1.57-1.78 (4H, m) 、

1.89-2.11 (2H, m) 、 2.22 (2H, t,  $J=7$ Hz) 、

3.31 (1H, ddd,  $J=11$ Hz, 11Hz, 5Hz) 、 3.58-

3.70 (1H, m) 、 5.42-5.51 (1H, m)

21 (1S, 2S) - 2 - (リノレオイルアミノ) シクロヘキサノール

化合物3.76g (収率100%)を得た。

性状；油状

質量分析 分子式； $C_{24}H_{43}NO_2$

理論値 377.3293

実測値 377.3299

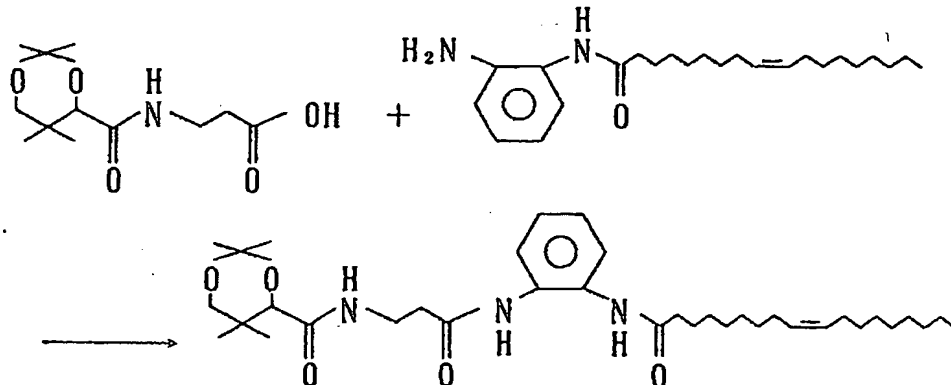
NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ) ; 0.89 (3H, t,  $J=7$ Hz) 、

50 1.12-1.41 (18H, m) 、 1.58-1.77 (4H, m) 、

(57)

113

1.89-2.18 (6H, m)、2.22 (2H, t, J=8Hz)、  
2.77 (2H, t, J=6Hz)、3.31 (2H, ddd, J=11Hz,  
11Hz, 5Hz)、3.59-3.70 (1H, m)、5.29-  
5.47 (5H, m)



2-アミノオレオイルアニリド-372mgと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸259mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド211mgを加え、そのまま1夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物500mg (収率82%)を得た。

性状；油状

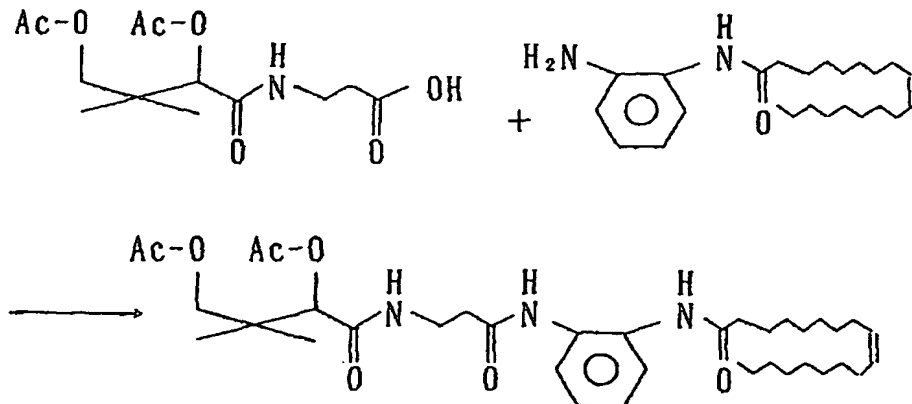
施光度  $[\alpha]_D$ ; +29.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_C$ =1664

質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 613.4454

実測値 613.4425



o-オレオイルアミノアニリン744mgと3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオン酸600mgとを塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷攪拌下、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド442mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留

\* 実施例-1

N-[2-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz)、

0.98 (3H, s)、1.04 (3H, s)、1.22-1.40

(20H, m)、1.42 (3H, s)、1.45 (3H, s)、

1.62-1.77 (2H, m)、1.94-2.09 (4H, m)、

2.36 (2H, t, J=7Hz)、2.60 (2H, t, J=6Hz)、

3.28 (1H, d, J=12Hz)、3.55-3.66 (2H, m)、

3.69 (1H, d, J=12Hz)、4.10 (1H, s)、

5.29-5.42 (2H, m)、7.14-7.48 (2H, m)、

7.39-7.48 (2H, m)、8.18 (1H, s)、8.60

(1H, brs)

実施例-2

N-[2-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

※

物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物810mg (収率62%)を得た。

性状；油状

施光度  $[\alpha]_D$ ; +6.30° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_C$ =1750, 1660

質量分析 分子式; C<sub>37</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

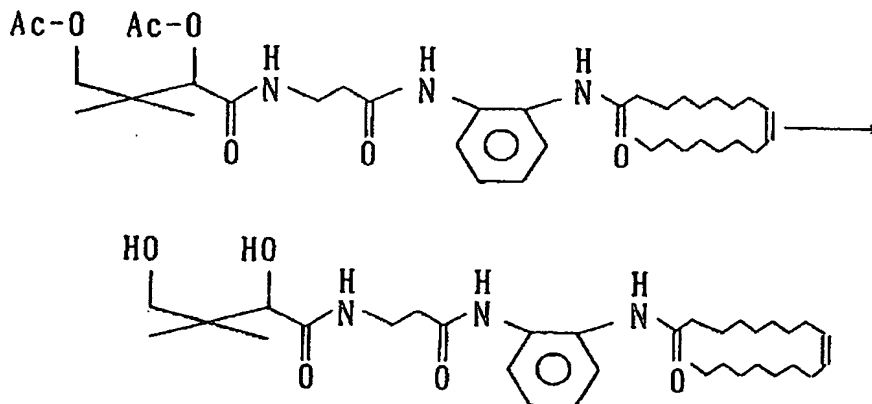
理論値 657.4352

(58)

115

実測値 657.4369

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) : 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ )、  
 1.02 (3H, s)、1.06 (3H, s)、1.23-1.45  
 (20H, m)、1.67-1.79 (2H, m)、1.95-  
 2.09 (4H, m)、2.03 (2H, s)、2.04 (3H, s)、  
 2.42 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ )、2.58 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ )、  
 3.49-3.72 (2H, m)、3.83 (2H, d,  $J=11\text{Hz}$ )、  
 4.02 (1H, d,  $J=11\text{Hz}$ )、4.89 (1H, s)、5.30



N-[2-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-  
 [N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキ  
 ソブチル)アミノ]プロパンアミド470mgをメタノール4  
 mlに溶かし、室温攪拌下に、1Nカセイソーダ水溶液1.5m  
 lを加えさらに30分間攪拌した。反応終了後、水10mlを  
 加え塩化メチレン20mlで抽出した。塩化メチレン層を水  
 次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥  
 の後、溶媒を留去の後、残留物をシリカゲルカラムクロ  
 マトグラフィーに供し、標記化合物377mg (収率94%)  
 を得た。

性状；油状

施光度  $[\alpha]_D$  ; +21.9° ( $C=1.0$ ,  $\text{CHCl}_3$ )IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat) ;  $\nu_{\text{C=O}}$  1660質量分析 分子式 ;  $\text{C}_{33}\text{H}_{55}\text{N}_3\text{O}_5$ 

116

\* - 5.44 (2H, m)、6.72-6.81 (1H, m)、7.19  
 - 7.32 (2H, m)、7.37 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ )、7.59  
 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ )、7.88 (1H, brs)、8.19 (1H,  
 brs)

実施例-3

N-[2-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-  
 (2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキシブ  
 チル)アミノ]プロパンアミド

※ 理論値 573.4141

実測値 573.4146

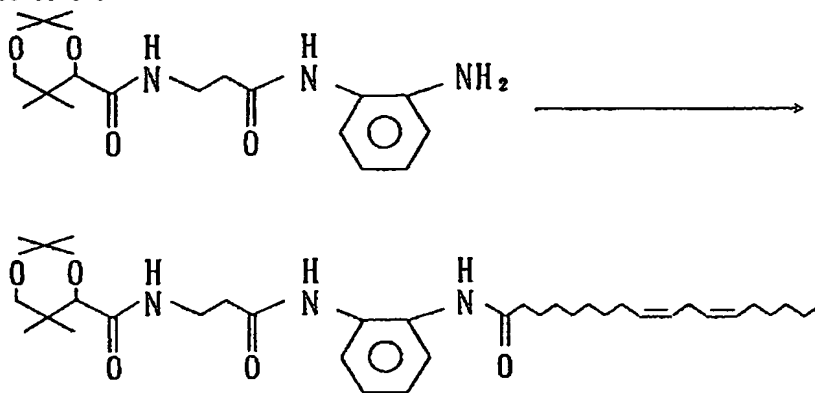
NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) : 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ )、  
 0.90 (3H, s)、0.97 (3H, s)、1.20-1.42  
 (20H, m)、1.62-1.76 (2H, m)、1.94-  
 2.01 (4H, m)、2.38 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ )、2.52  
 (2H, t,  $J=6\text{Hz}$ )、3.44 (2H, s)、3.49-3.72  
 (2H, m)、3.94 (1H, s)、5.28-5.42 (2H, m)、  
 7.13-7.21 (2H, m)、7.29-7.49 (3H, m)、  
 8.31 (1H, s)、8.69 (1H, s)

30

実施例-4

N-[2-(リノレオイルアミノ)フェニル]-3-  
 [N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-  
 -カルボニル)アミノ]プロパンアミド

※



N-(2-アミノフェニル)-3-[N-(2,2,5,5-  
 -テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-カルボニル)  
 アミノ]プロパンアミド349mgとリノール酸280mgとジシ  
 クロヘキシルカルボジイミド227mgとをトルエン15mlに

溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後生じた結晶  
 を濾過し、ろ液を濃縮し、残留物をシリカゲルカラムク  
 ロマトグラフィーに供し、標記化合物266mg (収率44  
 %)を得た。

50

(59)

117

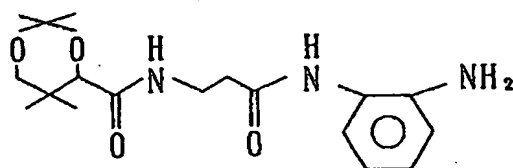
性状；油状

施光度  $[\alpha]_D$  ; +27.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{C=O}$  1662質量分析 分子式 ; C<sub>36</sub>H<sub>57</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 611.4298

実測値 611.4264

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.89 (3H, t, J=7Hz) 、  
0.98 (3H, s) 、 1.04 (3H, s) 、 1.23-1.44  
(14H, m) 、 1.42 (3H, s) 、 1.45 (3H, s) 、  
1.65-1.77 (2H, m) 、 1.91-2.10 (4H, m) 、



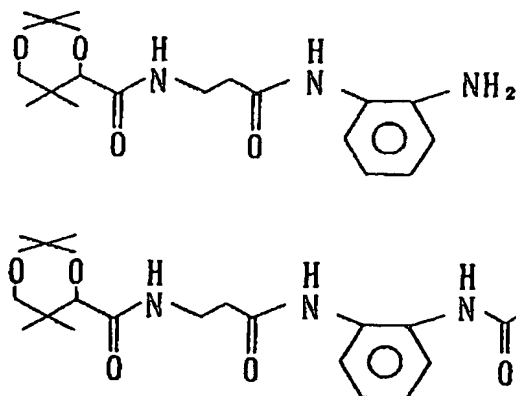
N-(2-アミノフェニル) - 3 - [N-(2,2,5,5-  
-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-カルボニル)  
アミノ] プロパンアミド349mgとリノレン酸278mgとジシ  
クロヘキシルカルボジイミド227mgとをトルエン15mlに  
溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後生じた結晶  
を濾過して除き、ろ液を濃縮し、シリカゲルカラムクロ  
マトグラフィーに供し、標記化合物271mg (収率45%)  
を得た。

性状；油状

施光度  $[\alpha]_D$  ; +26.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{C=O}$  1660質量分析 分子式 ; C<sub>36</sub>H<sub>55</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 609.4141

実測値 609.4144



N-(2-アミノフェニル) - 3 - [N-(2,2,5,5-  
-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-カルボニル)

118

\* 2.37 (2H, t, J=7Hz) 、 2.62 (2H, t, J=6Hz) 、  
2.77 (2H, t, J=6Hz) 、 3.28 (1H, d, J=12Hz) 、  
3.56-3.67 (2H, m) 、 3.69 (1H, d, J=12Hz) 、  
4.10 (1H, s) 、 5.29-5.44 (4H, m) 、 7.09  
(1H, t, J=6Hz) 、 7.15-7.22 (2H, m) 、 7.42  
- 7.49 (2H, m) 、 8.11 (1H, s) 、 8.55 (1H, s)

実施例-5

N-[2-(リノレノイルアミノ)フェニル]-3-  
[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-  
-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

\* 10

※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.97 (3H, t, J=7Hz) 、 0.98  
(3H, s) 、 1.04 (3H, s) 、 1.23-1.43 (8H, m) 、  
1.42 (3H, s) 、 1.46 (3H, s) 、 1.65-1.77  
(2H, m) 、 2.03-2.12 (4H, m) 、 2.38 (2H, t,  
J=7Hz) 、 2.63 (2H, t, J=6Hz) 、 2.75-2.83  
(4H, m) 、 3.28 (1H, d, J=12Hz) 、 3.58-  
3.70 (2H, m) 、 3.69 (1H, d, J=12Hz) 、 4.11  
(1H, s) 、 5.29-5.43 (6H, m) 、 7.09 (1H, t,  
J=6Hz) 、 7.17-7.22 (2H, m) 、 7.42-7.51  
(2H, m) 、 8.06 (1H, brs) 、 8.51 (1H, brs)

30

実施例-6

N-[2-(ステアロイルアミノ)フェニル]-3-  
[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-  
-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

※

アミノ] プロパンアミド349mgを塩化メチレン20mlに溶  
かし、氷冷撹拌下にピリジン1ml、次いで、ステアリン

50

(60)

119

酸クロリド303mgを塩化メチレン3mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去したのち、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物507mg (収率82%) を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D$  ; +27.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

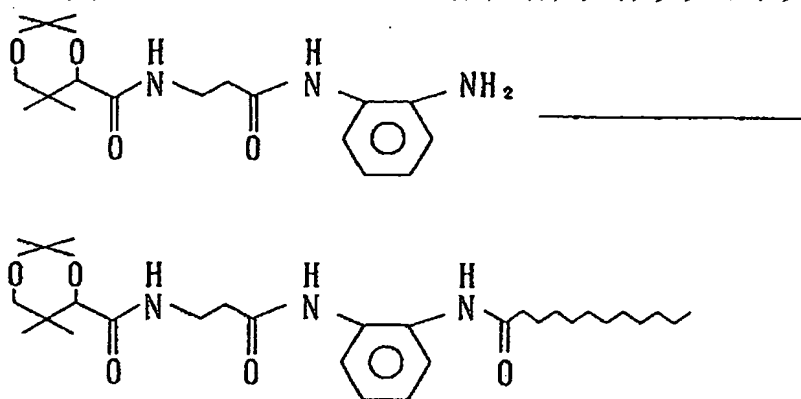
IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C=O}}$  1664

質量分析 分子式；C<sub>36</sub>H<sub>61</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 615.4611

実測値 615.4582

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、



N-(2-アミノフェニル) - 3 - [N-(2,2,5,5-  
-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)  
アミノ] プロパンアミド349mgを塩化メチレン20mlに溶かし、氷冷攪拌下にピリジン1ml、次いで、ラウリン酸  
クロリド219mgを塩化メチレン3mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残  
留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標  
記化合物454mg (収率86%) を得た。

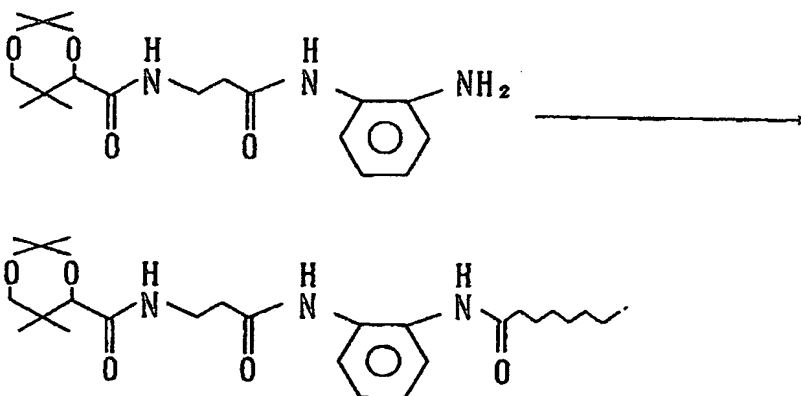
性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D$  ; +31.7° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C=O}}$  1664

質量分析 分子式；C<sub>30</sub>H<sub>49</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 531.3672



120

\* 0.98 (3H, s) 、1.04 (3H, s) 、1.20-1.43  
(28H, m) 、1.43 (3H, s) 、1.46 (3H, s) 、  
1.68-1.78 (2H, m) 、2.40 (2H, t, J=7Hz) 、  
2.65 (2H, t, J=6Hz) 、3.28 (1H, d, J=12Hz) 、  
3.58-3.72 (2H, m) 、3.69 (1H, d, J=12Hz) 、  
4.11 (1H, s) 、7.08 (1H, t, J=6Hz) 、7.17-  
7.23 (2H, m) 、7.42-7.53 (2H, m) 、8.00  
(1H, s) 、8.49 (1H, s)

実施例-7

10 N-[2-(ラウロイルアミノ)フェニル]-3-[N-  
(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カ  
ルボニル)アミノ]プロパンアミド

実測値 531.3692

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
0.98 (3H, s) 、1.04 (3H, s) 、1.21-1.43  
(16H, m) 、1.42 (3H, s) 、1.45 (3H, s) 、  
1.65-1.77 (2H, m) 、2.38 (2H, t, J=7Hz) 、  
2.61 (2H, t, J=6Hz) 、3.28 (1H, d, J=12Hz) 、  
3.55-3.68 (2H, m) 、3.69 (1H, d, J=12Hz) 、  
4.10 (1H, s) 、7.09 (1H, t, J=12Hz) 、7.14  
- 7.22 (2H, m) 、7.40-7.49 (2H, m) 、8.13  
(1H, s) 、8.57 (1H, s)

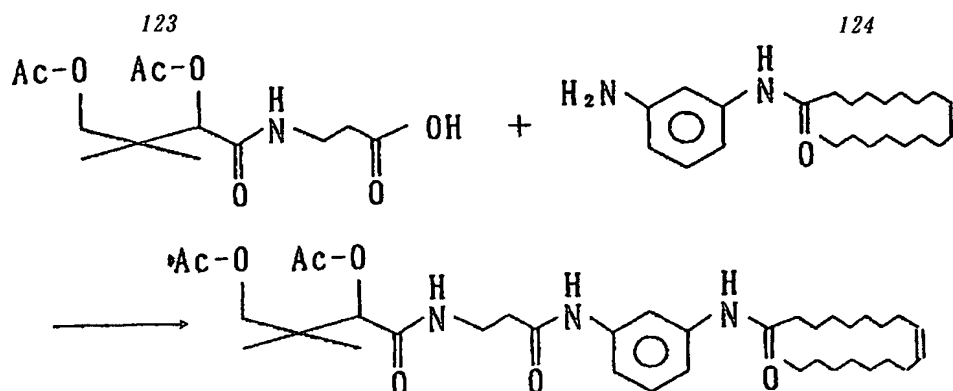
実施例-8

N-[2-(オクタノイルアミノ)フェニル]-3-  
[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4  
-カルボニル)アミノ]プロパンアミド





(62)



m-オレオイルアミノアニリン744mgと3-〔N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソプロチル)アミノ〕プロピオン酸606mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド422mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物860mg(収率65%)を得た。

性状；油状

施光度 $[\alpha]_D$ ；+12.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)； $\nu_{C=O}$ 1750, 1668

質量分析 分子式；C<sub>37</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 657.4352

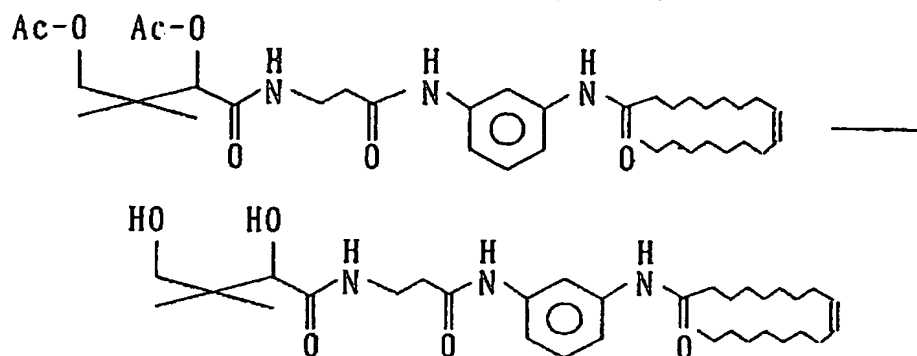
実測値 657.4342

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.89 (3H, t, J=7Hz) ,  
1.03 (3H, s) , 1.05 (3H, s) , 1.21-1.42  
(20H, m) , 1.61-1.77 (2H, m) , 1.97-  
2.13 (4H, m) , 2.05 (3H, s) , 2.10 (3H, s) ,  
2.33 (2H, t, J=7Hz) , 2.56 (2H, t, J=6Hz) ,  
3.55-3.68 (2H, m) , 3.87 (1H, d, J=11Hz) ,  
4.02 (1H, d, J=10Hz) , 4.91 (1H, s) , 5.29  
- 5.42 (2H, m) , 6.84 (1H, d, J=6Hz) , 7.25  
20 (1H, d, J=8Hz) , 7.33 (1H, d, J=8Hz) , 7.41  
(1H, d, J=8Hz) , 7.54 (1H, brs) , 7.63 (1H, br  
s) , 8.01 (1H, brs)

実施例-11

N-〔3-(オレオイルアミノ)フェニル〕-3-〔N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソプロチル)アミノ〕プロパンアミド

\*



N-〔3-(オレオイルアミノ)フェニル〕-3-〔N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソプロチル)アミノ〕プロパンアミド470mgをメタノール4 mlに溶かし、室温攪拌下に、1Nカセイソーダ水溶液1.5mlを加え、さらに30分間攪拌した。反応終了後、水10mlを加え塩化メチレン20mlで抽出した。塩化メチレン層を水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去の後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物378mg(収率94%)を得た。

性状；油状

施光度 $[\alpha]_D$ ；+23.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)； $\nu_{C=O}$ 1660

質量分析 分子式；C<sub>33</sub>H<sub>55</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 573.4141

実測値 573.4146

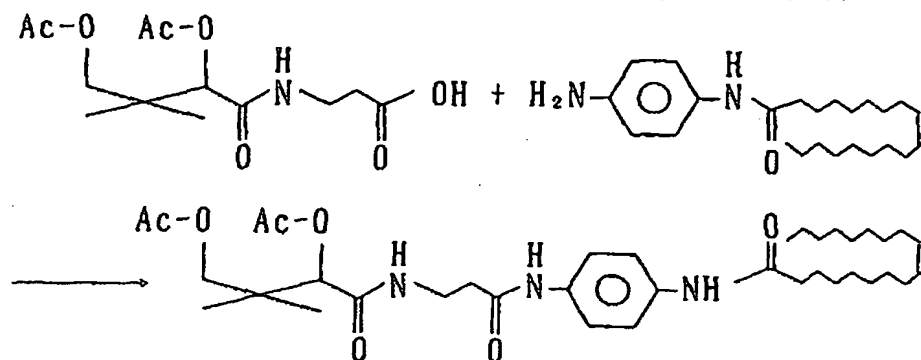
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
0.91 (3H, s) , 0.98 (3H, s) , 1.21-1.42  
(20H, m) , 1.62-1.73 (2H, m) , 1.93-  
2.10 (4H, m) , 2.32 (2H, t, J=7Hz) , 2.52  
(2H, brs) , 3.50-3.70 (2H, m) , 4.01 (1H,  
s) , 5.29-5.43 (2H, m) , 7.17-7.31 (3H,  
m) , 7.53-7.62 (1H, m) , 7.71 (1H, brs) ,  
7.92-8.00 (1H, m) , 8.46-8.55 (1H, m)

実施例-12

50 N-〔4-(オレオイルアミノ)フェニル〕-3-〔N

(63)

125  
 — (2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブ\* \*チル) アミノ] プロパンアミド



p-オレオイルアミノアニリン744mgと3-〔N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ〕プロピオン酸606mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド422mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物900mg (収率69%)を得た。

性状；油状

施光度〔α〕<sub>D</sub>；+17.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)；ν<sub>C=O</sub>1754, 1660

質量分析 分子式；C<sub>37</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 657.4352

実測値 657.4357

※NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>)；0.88 (3H, t, J=7Hz)、

1.02 (3H, s)、1.05 (3H, s)、1.19-1.43

(20H, m)、1.66-1.77 (2H, m)、1.92-

2.09 (4H, m)、2.05 (3H, s)、2.08 (3H, s)、

2.34 (2H, t, J=7Hz)、2.56 (2H, t, J=6Hz)、

3.50-3.71 (2H, m)、3.84 (1H, d, J=11Hz)、

4.02 (1H, d, J=11Hz)、4.89 (1H, s)、

5.29-5.42 (2H, m)、6.76 (1H, t, J=6Hz)、

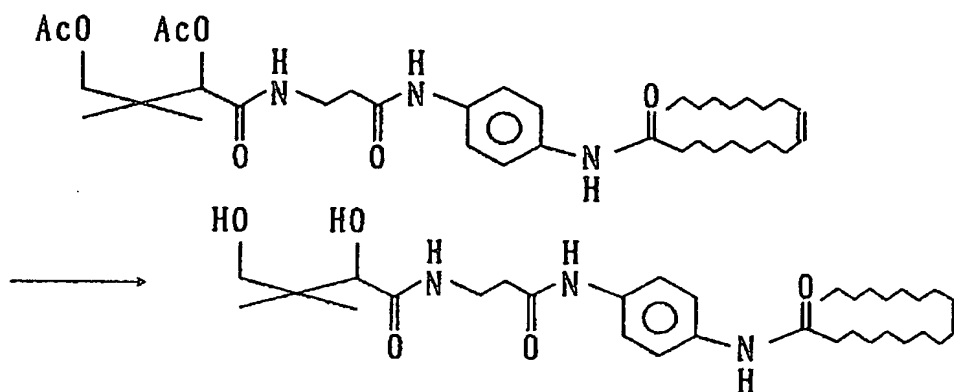
7.13 (1H, brs)、7.44-7.52 (4H, m)、7.64

(1H, brs)

実施例-13

N-(4-(オレオイルアミノ)フェニル)-3-〔N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ〕プロパンアミド

※



N-(4-(オレオイルアミノ)フェニル)-3-〔N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ〕プロパンアミド657mgをメタノール4mlに溶かし、室温攪拌下に、1Nカセイソーダ水溶液1.5mlを加え、さらに30分間攪拌した。反応終了後、水10mlを加え塩化メチレン20mlで抽出した。塩化メチレン層を水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去の後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物495mg (収率86%)を得た。

性状；融点 146.2~148.1°C

施光度〔α〕<sub>D</sub>；+10.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)；ν<sub>C=O</sub>1664

質量分析 分子式；C<sub>37</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 573.4141

実測値 573.4144

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>)；0.88 (3H, t, J=7Hz)、

0.89 (3H, s)、0.95 (3H, s)、1.15-1.43

(20H, m)、1.62-1.77 (2H, m)、1.92-

2.08 (4H, m)、2.34 (2H, t, J=7Hz)、2.56

(2H, brs)、3.45 (2H, s)、3.58 (2H, brs)、

3.96 (1H, s)、5.27-5.42 (2H, m)、7.25-

7.39 (4H, m)、7.48 (1H, brs)、7.71 (1H,

brs)、8.54 (1H, brs)

(64)

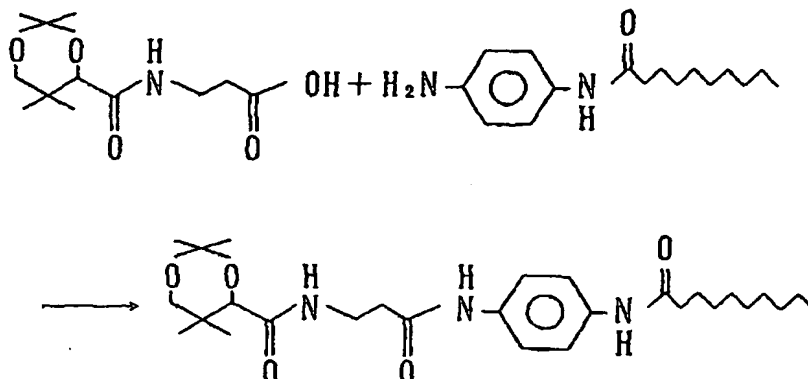
127

## 実施例-14

N-[4-(ラウロイルアミノ)フェニル]-3-[N\*

128

\*(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド



4-ラウロイルアミノアニリン250mgと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸223mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸1エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド181mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物381mg(収率72%)を得た。

性状; 融点 144.3~144.9℃

旋光度 $[\alpha]_D$ ; +34.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1664

質量分析 分子式; C<sub>30</sub>H<sub>49</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 531.3672

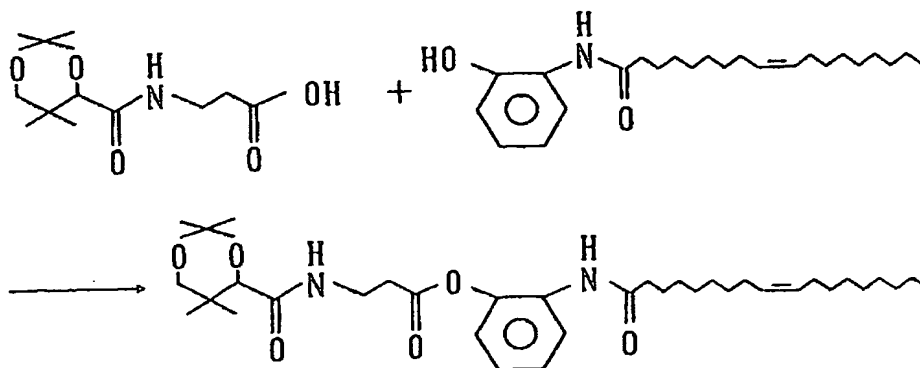
※ 実測値 531.3675

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.95 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.22-1.40 (16H, m), 1.41 (3H, s), 1.45 (3H, s), 1.68-1.80 (2H, m), 2.34 (2H, t, J=7Hz), 2.65 (2H, t, J=6Hz), 3.27 (1H, d, J=12Hz), 3.50-3.75 (2H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.10 (1H, s), 7.08 (1H, d, J=6Hz), 7.16 (1H, s), 7.46 (2H, d, J=8Hz), 7.49 (2H, d, J=8Hz), 8.09 (1H, s)

## 実施例-15

2-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

※



2-オレオイルアミノフェノール303mgと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸259mgとジシクロヘキシルカルボジイミド227mg及び4-ジメチルアミノピリジン122mgとをトルエン15mlに溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後生じた結晶を濾過して除き、ろ液を濃縮し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物445mg(収率72%)を得た。

性状; 油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ; +26.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1772, 1658

質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 614.4294

実測値 614.4271

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.99 (3H, s), 1.00 (3H, s), 1.22-1.43 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.65-1.78 (2H, m), 1.93-2.08 (4H, m), 2.44 (2H, t, J=7Hz), 2.80 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.69-3.82 (2H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.09 (1H, s), 5.29-5.39 (2H, m), 7.00 (1H, t, J=6Hz), 7.06-7.12 (2H, m), 7.19-7.27 (1H, m), 8.22 (1H, d, J=8Hz), 8.39 (1H, s)

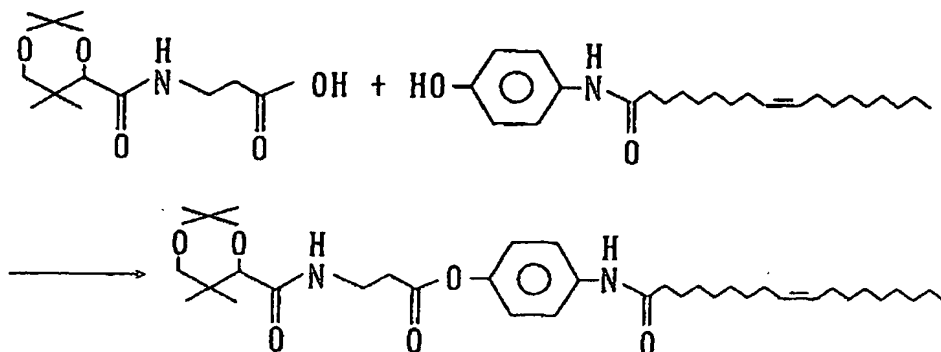
(65)

129

130

## 実施例-16

4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,2,\*

\*5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
ル)アミノ]プロピオネート

p-ヒドロキシオレオイルアニリド565mgと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸393mgとジシクロヘキシルカルボジイミド345mg及び4-ジメチルアミノピリジン204mgとをトルエン15mlに溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後生じた結晶を濾過して除き、ろ液を濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物930mg(収率99%)を得た。

性状；油状

施光度 $[\alpha]_D$ ；+18.8°(C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat)； $\nu_{C=O}$ 1760, 1662質量分析 分子式；C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 614.4294

実測値 614.4312

※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>)；0.88 (3H, t, J=7Hz)、

1.00 (3H, s)、1.06 (3H, s)、1.23-1.43

(20H, m)、1.43 (3H, s)、1.45 (3H, s)、

1.65-1.78 (2H, m)、1.93-2.09 (4H, m)、

2.35 (2H, t, J=7Hz)、2.82 (2H, t, J=6Hz)、

3.29 (1H, d, J=12Hz)、3.52-3.77 (2H, m)、

3.70 (1H, d, J=12Hz)、4.11 (1H, s)、5.29

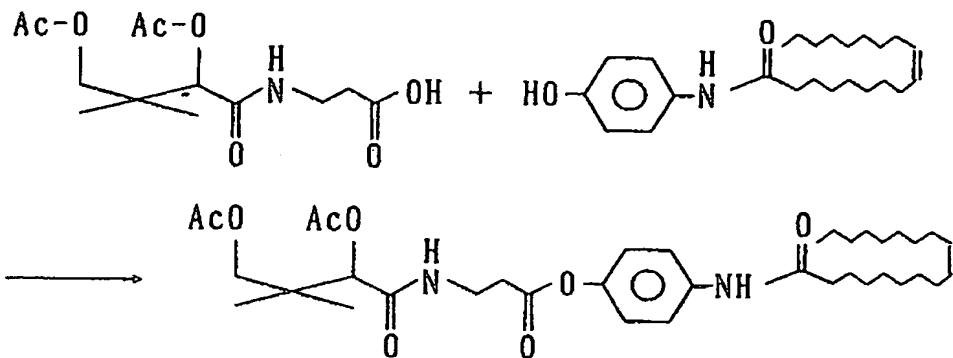
20 -5.41 (2H, m)、6.98-7.07 (1H, m)、7.03

(2H, d, J=8Hz)、7.54 (2H, d, J=8Hz)、7.18

(1H, s)

## 実施例-17

4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート



p-オレオイルアミノフェノール372mgと3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオン酸259mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド211mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物255mg(収率39%)を得た。

性状；油状

施光度 $[\alpha]_D$ ；+19.4°(C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat)； $\nu_{C=O}$ 1750, 1666質量分析 分子式；C<sub>37</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>8</sub>

理論値 658.4193

実測値 658.4191

40 ※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>)；0.88 (3H, t, J=7Hz)、

1.03 (3H, s)、1.08 (3H, s)、1.22-1.42

(20H, m)、1.66-1.78 (2H, m)、1.96-

2.07 (4H, m)、2.01 (3H, s)、2.04 (3H, s)、

2.35 (2H, t, J=7Hz)、2.77-2.82 (2H, m)、

3.84 (1H, d, J=12Hz)、4.05 (1H, d, J=12Hz)、

4.97 (1H, s)、5.27-5.42 (2H, m)、6.61

(1H, t, J=6Hz)、7.04 (2H, d, J=8Hz)、7.15

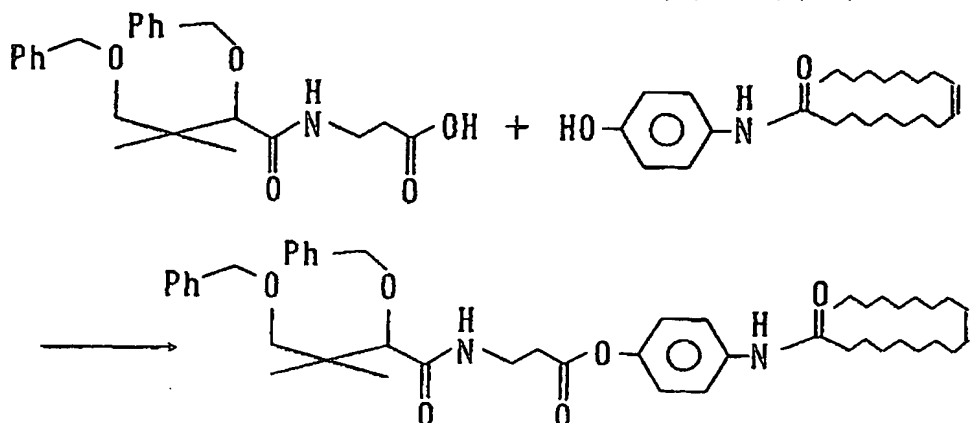
(1H, brs)、7.54 (2H, d, J=8Hz)

## 実施例-18

50 4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,4

(66)

131  
 -ジベンジルオキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル \* \*ル) アミノ] プロピオネート  
 132



3-[N-(2,4-ジベンジルオキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオン酸200mgと4-(オレオイルアミノ)フェノール186mgとジシクロヘキシルカルボジイミド124mg及び4-ジメチルアミノピリジン67mgとをトルエン15mlに溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後、生じた結晶を濾過し、ろ液を濃縮し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物312mg (収率97%)を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D$  ; +19.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{C=O}$  1760, 1652

質量分析 分子式 ; C<sub>47</sub>H<sub>66</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

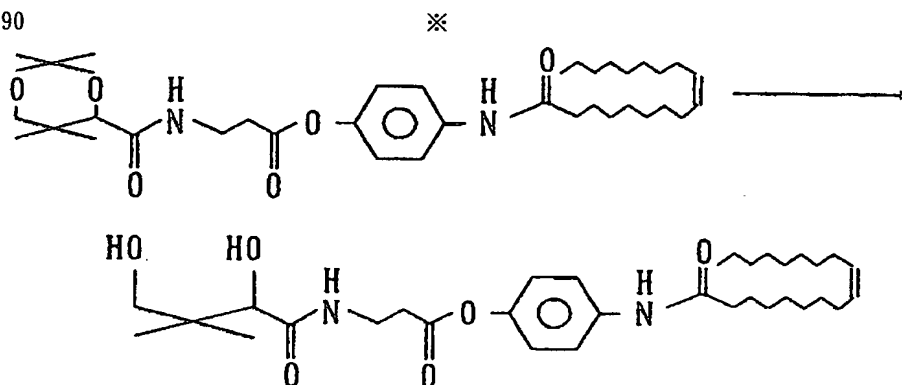
理論値 754.4920

実測値 754.4890

※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.94 (3H, s) , 1.05 (3H, s) , 1.20-1.41 (20H, m) , 1.64-1.75 (2H, m) , 1.95-2.09 (4H, m) , 2.34 (3H, s) , 2.75 (3H, t, J=7Hz) , 3.23 (1H, t, J=9Hz) , 3.61 (2H, dd, J=6Hz) , 3.41 (1H, d, J=9Hz) , 3.90 (1H, s) , 4.34-4.55 (4H, m) , 5.29-5.42 (2H, m) , 6.95 (2H, d, J=8Hz) , 7.03 (1H, d, J=8Hz) , 7.23-7.39 (10H, m) , 7.50 (2H, d, J=8Hz)

実施例-19

4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート



4-(オレオイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニルアミノ)プロピオネート500mgを酢酸20mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし、室温で一晩攪拌した。反応終了後、水20mlを加え塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を水洗し無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物395mg (収率85%)を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D$  ; +14.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{C=O}$  1758, 1662

質量分析 分子式 ; C<sub>33</sub>H<sub>54</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 574.3981

実測値 574.3952

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.93 (3H, s) , 1.03 (3H, s) , 1.21-1.43 (20H, m) , 1.65-1.71 (2H, m) , 1.71-2.18 (6H, m) , 2.35 (2H, t, J=7Hz) , 2.82 (2H, t, J=6Hz) , 3.50 (1H, d, J=10Hz) , 3.60-3.74 (2H, m) , 3.54 (1H, d, J=10Hz) , 4.04 (1H, s) , 5.28-5.43 (2H, m) , 7.15-7.26 (2H, m) , 7.04 (2H, d, J=8Hz) , 7.52 (2H, d, J=8Hz)

実施例-20

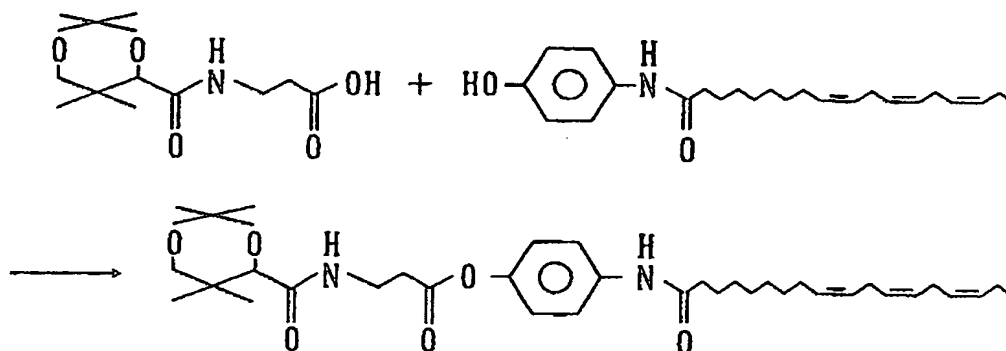
4-(リノレノイルアミノ)フェニル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニル

(67)

ル) アミノ] プロピオネート

133

134



4-リノレノイルアミノフェノール369mgと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸259mgとジシクロヘキシルカルボジイミド227mg及び4-ジメチルアミノピリジン122mgとをトルエン15mlに溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後生じた結晶を濾過して除き、ろ液を濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物431mg(収率71%)を得た。

性状; 油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ; +20.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1760, 1662質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>52</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 608.3825

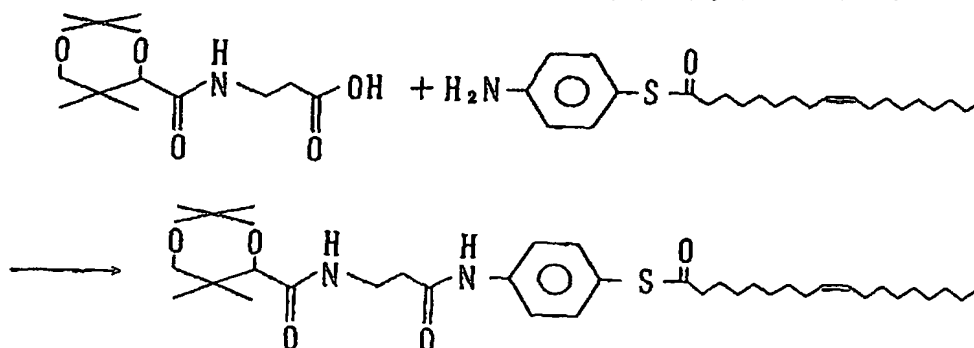
実測値 608.3836

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.98 (3H, t, J=7Hz), 1.00 (3H, s), 1.06 (3H, s), 1.24-1.42 (8H, m), 1.43 (3H, s), 1.45 (3H, s), 1.64-1.78 (2H, m), 2.01-2.12 (4H, m), 2.35 (2H, t, J=7Hz), 2.72-2.86 (6H, m), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.52-3.77 (2H, m), 3.70 (1H, d, J=12Hz), 4.11 (1H, s), 5.28-5.44 (6H, m), 7.00 (1H, t, J=6Hz), 7.03 (2H, d, J=8Hz), 7.15 (1H, s), 7.54 (2H, d, J=8Hz)

実施例-21

N-[4-(オレオイルチオ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

\*



S-4-アミノフェニル チオオレエート778mgと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸518mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸 1-エチル-3-(ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド422mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物1.05g(収率83%)を得た。

性状; 油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ; +29.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1696, 1666質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S

理論値 630.4066

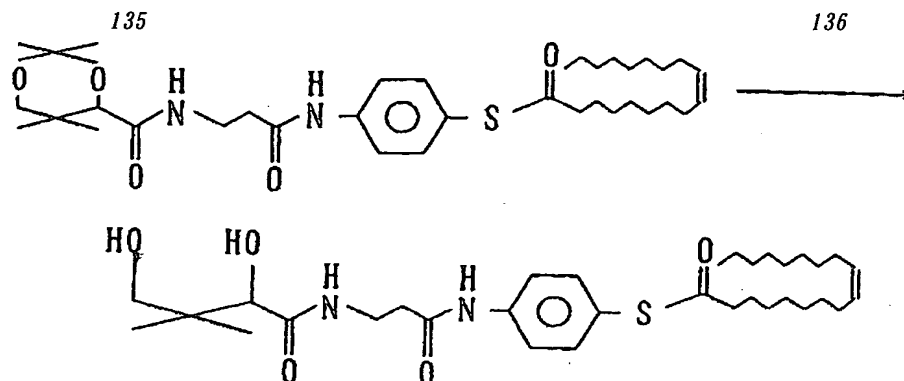
実測値 630.4069

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.90 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.22-1.39 (20H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.60-1.74 (2H, m), 1.92-2.09 (4H, m), 2.63 (2H, t, J=7Hz), 2.68 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.54-3.75 (2H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.10 (1H, s), 5.30-5.42 (2H, m), 7.08 (1H, t, J=6Hz), 7.35 (2H, d, J=8Hz), 7.63 (2H, d, J=8Hz), 8.29 (1H, s)

実施例-22

N-[4-(オレオイルチオ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

(68)



N-[4-(オレオイルチオ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド500mgを酢酸20mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし、室温で一晩攪拌した。反応終了後、水20mlを加え塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を水洗し無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物406mg(収率87%)を得た。

性状；油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ; +16.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1670

質量分析 分子式; C<sub>33</sub>H<sub>54</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S

理論値 590.3753

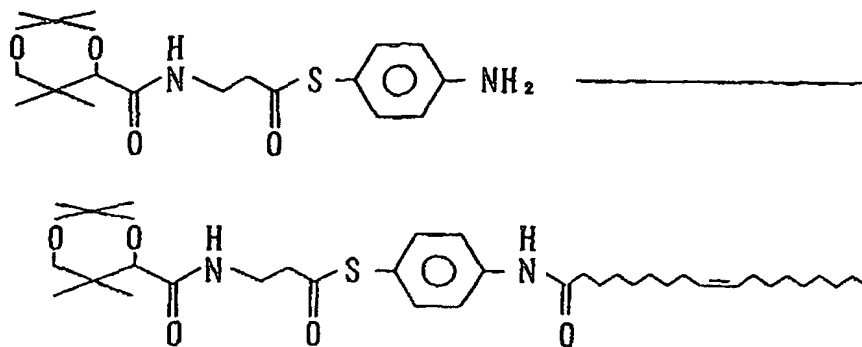
実測値 590.3731

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.91 (3H, s), 0.98 (3H, s), 1.20-1.42 (20H, m), 1.65-1.77 (2H, m), 1.93-2.09 (4H, m), 2.57 (2H, t, J=6Hz), 2.66 (2H, t, J=6Hz), 3.25 (2H, brs), 3.48 (2H, brs), 3.50-3.69 (2H, m), 4.01 (1H, s), 5.30-5.42 (2H, m), 7.28 (2H, d, J=9Hz), 7.50 (2H, d, J=9Hz), 7.54 (2H, d, J=6Hz), 8.62 (1H, s)

#### 20 実施例-23

S-[4-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンチオエート

\*



S-4-アミノフェニル-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンチオエート281mgを塩化メチレン20mlに溶かし、氷冷攪拌下にピリジン1ml、次いで、オレイン酸クロリド229mgを塩化メチレン3mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物185mg(収率38%)を得た。

性状；油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ; +7.90° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1704, 1652

質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S

理論値 630.4066

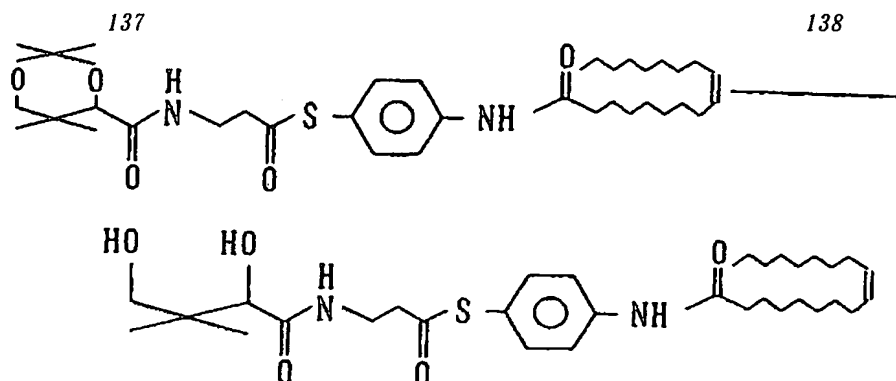
実測値 630.4044

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.00 (3H, s), 1.05 (3H, s), 1.15-1.42 (20H, m), 1.42 (3H, s), 1.45 (3H, s), 1.65-1.79 (2H, m), 1.92-2.08 (4H, m), 2.37 (2H, t, J=7Hz), 2.82-3.01 (2H, m), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.47-3.69 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.09 (1H, s), 5.29-5.42 (2H, m), 6.85-6.92 (1H, m), 7.16 (1H, s), 7.34 (2H, d, J=8Hz), 7.60 (2H, d, J=8Hz)

#### 実施例-24

S-[4-(オレオイルアミノ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジヒドロ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンチオエート

(69)



S-[4-(オレオイルアミノ)フェニル]3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニル)アミノ]プロパンチオエート483mgを酢酸20mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし、室温で一晩攪拌した。反応終了後、水20mlを加え塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を水洗し無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物404mg(収率89%)を得た。

性状；油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ; +8.80° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1698, 1670

質量分析 分子式; C<sub>33</sub>H<sub>54</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S

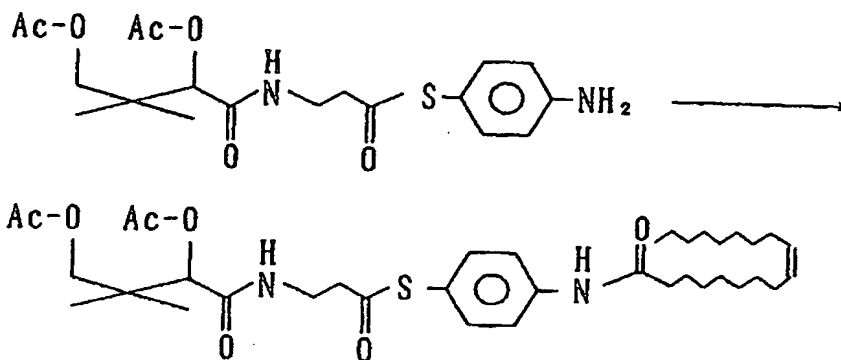
理論値 590.3753

\* 実測値 590.3762

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.91 (3H, s), 1.02 (3H, s), 1.19-1.43 (20H, m), 1.67-1.79 (2H, m), 1.87-2.17 (6H, m), 2.36 (2H, t, J=7Hz), 2.92 (2H, t, J=6Hz), 3.48 (1H, d, J=12Hz), 3.53 (1H, d, J=12Hz), 3.56-3.65 (2H, m), 4.01 (1H, s), 5.28-5.42 (2H, m), 7.12 (1H, t, J=6Hz), 7.26 (1H, brs), 7.34 (2H, d, J=8Hz), 7.59 (2H, d, J=8Hz)

実施例-25

S-[4-(オレオイルアミノ)フェニル]3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンチオエート



S-[4-アミノフェニル]3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンチオエート276mgを塩化メチレン20mlに溶かし、氷冷攪拌下にピリジン1ml、次いで、オレイン酸クロリド196mgを塩化メチレン3mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物304mg(収率69%)を得た。

性状；油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ; +21.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1750, 1670

質量分析 分子式; C<sub>37</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>7</sub>S

理論値 674.3964

実測値 674.3976

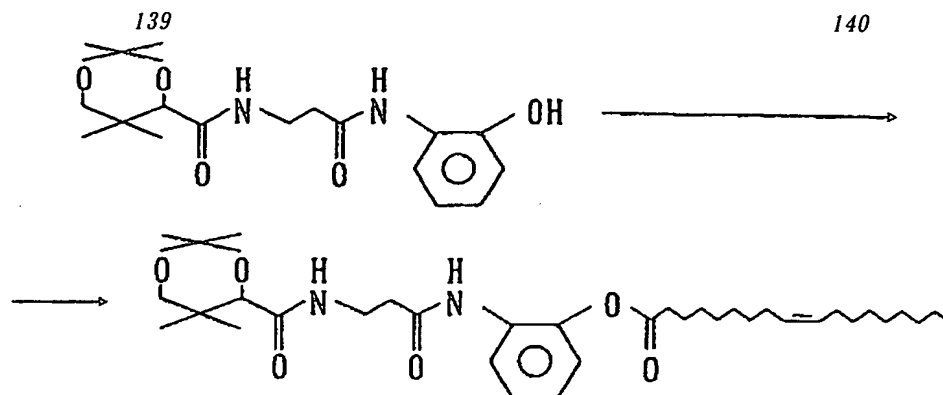
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.00 (3H, s), 1.06 (3H, s), 1.21-1.33 (20H, m), 1.62-1.77 (2H, m), 1.94-2.08 (4H, m), 2.06 (3H, s), 2.10 (3H, s), 2.37 (2H, t, J=7Hz), 2.89 (2H, t, J=6Hz), 3.44-3.68 (2H, m), 3.82 (1H, d, J=11Hz), 4.03 (1H, d, J=11Hz), 4.97 (1H, s), 5.29-5.41 (2H, m), 6.47 (1H, t, J=6Hz), 7.19-7.32 (2H, m), 7.17 (1H, s), 7.35 (2H, d, J=8Hz), 7.61 (2H, d, J=8Hz)

実施例-26

N-[2-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキササン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド



(70)



N-(2-ヒドロキシフェニル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド350mgとオレイン酸282mgとジシクロヘキシルカルボジイミド227mg及び4-ジメチルアミノピリジン122mgとをトルエン15mlに溶かし2時間加熱還流した。反応液を冷却後生じた結晶を濾過して除き、ろ液を濃縮し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物411mg(収率67%)を得た。

性状；油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ；+32.3°(C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)； $\nu_{\text{C=O}}$ 1768, 1668

質量分析 分子式；C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

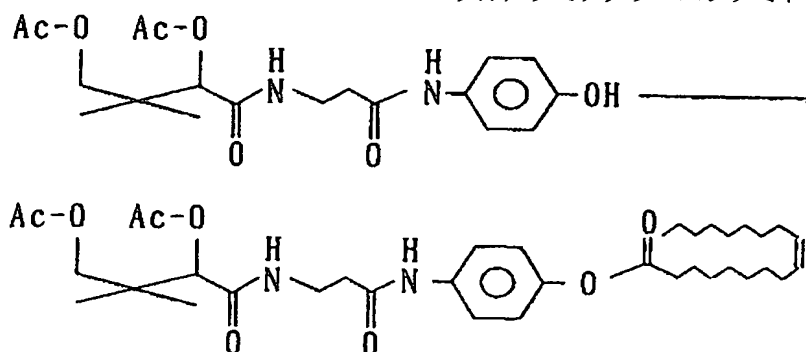
理論値 614.4294

\* 実測値 614.4294

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
0.96 (3H, s) 、 1.03 (3H, s) 、 1.23-1.45  
(20H, m) 、 1.40 (3H, s) 、 1.45 (3H, s) 、  
1.71-1.83 (2H, m) 、 1.92-2.08 (4H, m) 、  
2.58-2.67 (4H, m) 、 3.27 (2H, d, J=12Hz) 、  
3.56-3.64 (2H, m) 、 3.67 (1H, d, J=12Hz) 、  
4.07 (1H, s) 、 5.30-5.42 (2H, m) 、 7.03-  
7.17 (3H, m) 、 7.19-7.29 (1H, m) 、 7.49  
(1H, brs) 、 8.18 (1H, s, J=8Hz)

実施例-27

N-[4-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド



N-(4-ヒドロキシフェニル)-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド394mgを塩化メチレン20mlに溶かし、氷冷攪拌下にピリジン1ml、次いで、オレイン酸クロリド301mgを塩化メチレン3mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物530mg(収率81%)を得た。

性状；油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ；+14.9°(C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)； $\nu_{\text{C=O}}$ 1746, 1666

質量分析 分子式；C<sub>37</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>8</sub>

理論値 658.4193

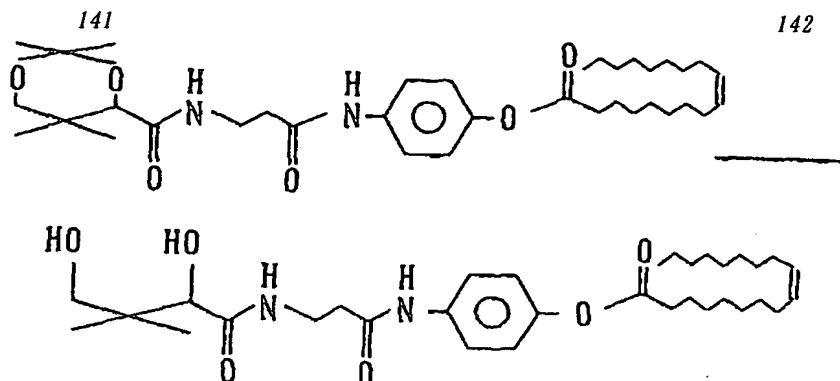
実測値 658.4184

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
1.02 (3H, s) 、 1.05 (3H, s) 、 1.22-1.42  
(20H, m) 、 1.68-1.79 (2H, m) 、 1.94-  
2.09 (4H, m) 、 2.05 (3H, s) 、 2.07 (3H, s) 、  
2.51-2.59 (4H, m) 、 3.54-3.71 (2H, m) 、  
3.84 (1H, d, J=12Hz) 、 4.02 (1H, d, J=12Hz) 、  
4.88 (1H, s) 、 5.28-5.42 (2H, m) 、 6.72  
(1H, t, J=6Hz) 、 7.34 (2H, d, J=8Hz) 、 7.54  
(2H, d, J=8Hz) 、 7.71 (1H, brs)

実施例-28

N-[4-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

(71)



N-[4-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド1.0gを酢酸20mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後、水20mlを加え塩化メチレンで抽出した。塩化メチレン層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去後、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し標記化合物830mg(収率89%)を得た。

性状；油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ；+21.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)； $\nu_{C=O}$ 1760, 1660

質量分析 分子式；C<sub>33</sub>H<sub>54</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 574.3981

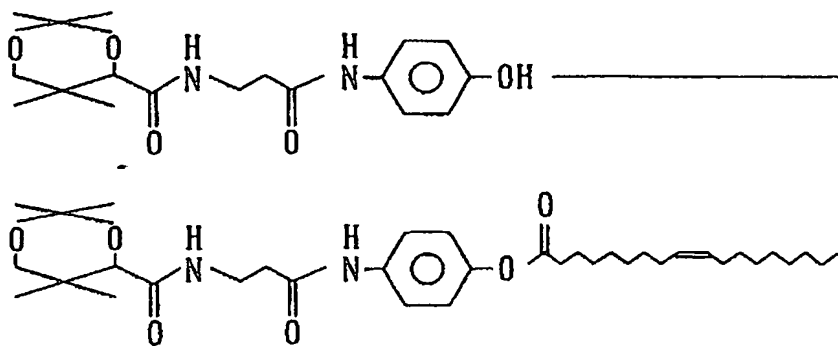
実測値 574.3977

\*NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
0.90 (3H, s) 、 0.98 (3H, s) 、 1.19-1.46  
(20H, m) 、 1.41 (3H, s) 、 1.68-1.79 (2H,  
m) 、 1.93-2.09 (4H, m) 、 2.55 (2H, t, J=7Hz) 、 2.  
59 (2H, t, J=6Hz) 、 2.72 (2H, brs) 、  
3.55-3.68 (2H, m) 、 3.48 (2H, s) 、 3.98  
(1H, s) 、 5.29-5.42 (2H, m) 、 7.45-7.53  
(1H, m) 、 7.00 (2H, d, J=8Hz) 、 7.52 (2H, d,  
8Hz) 、 8.35 (1H, s)

#### 20 実施例-29

N-[4-(オレオイルオキシ)フェニル]-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

\*



N-(4-ヒドロキシフェニル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド1.44gを塩化メチレン20mlに溶かし、氷冷攪拌下にピリジン5ml、次いで、オレイン酸クロリド1.20gを塩化メチレン10mlに溶かした溶液を滴下し、さらに1時間攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物1.93g(収率79%)を得た。

性状；油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ；+32.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)； $\nu_{C=O}$ 1764, 1668

質量分析 分子式；C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 614.4294

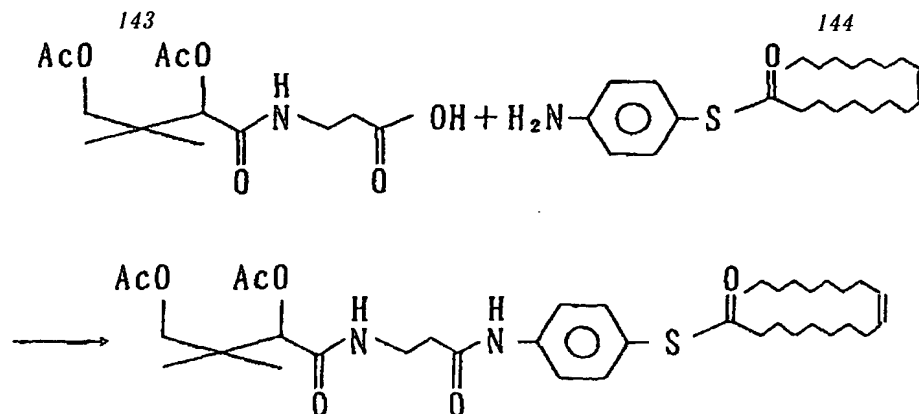
実測値 614.4319

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
0.96 (3H, s) 、 1.04 (3H, s) 、 1.23-1.45  
(20H, m) 、 1.41 (3H, s) 、 1.46 (3H, s) 、  
1.66-1.70 (2H, m) 、 1.93-2.09 (4H, m) 、  
2.54 (2H, t, J=7Hz) 、 2.66 (2H, t, J=6Hz) 、  
3.27 (1H, d, J=12Hz) 、 3.52-3.77 (2H, m) 、  
3.68 (1H, d, J=12Hz) 、 4.10 (1H, s) 、  
5.29-5.42 (2H, m) 、 7.01-7.10 (1H, m) 、  
7.01 (2H, d, J=8Hz) 、 7.57 (2H, d, J=8Hz)  
8.11 (1H, s)

#### 実施例-30

N-[4-(オレオイルチオ)フェニル]-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

(72)



S-p-アミノフェニル チオオレエート779mgと3-〔N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ〕プロピオン酸606mgとを、塩化メチレン30mlに溶かし、氷冷下、塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド442mgを加え、そのまま一夜攪拌した。反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥の後、溶媒を留去した。次いで、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物780mg (収率58%)を得た。

性状；油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ；+14.5° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)； $\nu_{C=O}$ 1748, 1672

質量分析 分子式；C<sub>37</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>7</sub>S

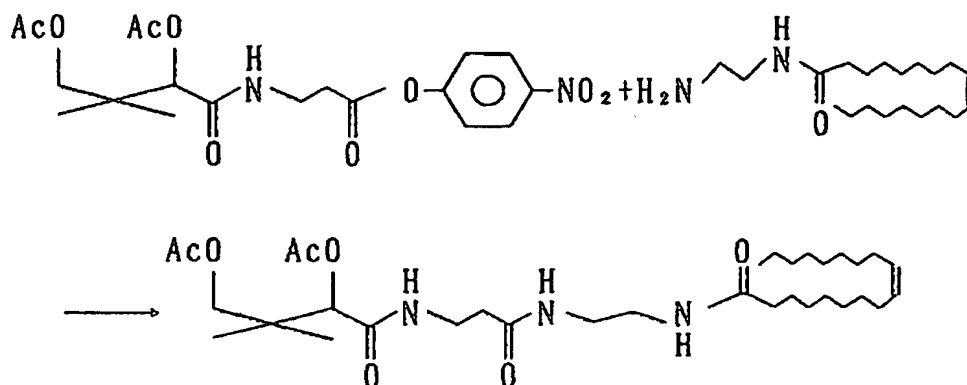
理論値 674.3964

実測値 674.3991

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.89 (3H, t, J=7Hz) , 1.03 (3H, s) , 1.06 (3H, s) , 1.22-1.41 (20H, m) , 1.64-1.75 (2H, m) , 1.96-2.08 (4H, m) , 2.05 (3H, s) , 2.08 (3H, s) , 2.58 (2H, t, J=6Hz) , 2.64 (2H, t, J=7Hz) , 3.55 - 3.70 (2H, m) , 3.85 (1H, d, J=11Hz) , 4.02 (1H, d, J=11Hz) , 4.87 (1H, s) , 5.28 - 5.43 (2H, m) , 6.69 (1H, t, J=6Hz) , 7.34 (1H, d, J=8Hz) , 7.60 (2H, d, J=8Hz) , 7.81 (1H, brs)

実施例-31

N-(2-N-オレオイルアミノエチル)-3-〔N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ〕プロパンアミド



N-(2-アミノエチル) オレオイルアミド1.07gと4-ニトロフェニル 3-〔N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ〕プロピオン酸1.40gとをテトラヒドロフラン40mlに溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後、溶媒を減圧下に留去し、残留物を酢酸エチルに溶かし、炭酸カリウム水溶液、次いで、水で洗浄し、有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、標記化合物4.45g (収率75%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)； $\nu_{C-H}$ 2980,  $\nu_{C=O}$ 1740, 1650

質量分析 分子式；C<sub>33</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 609.4352

実測値 609.4342

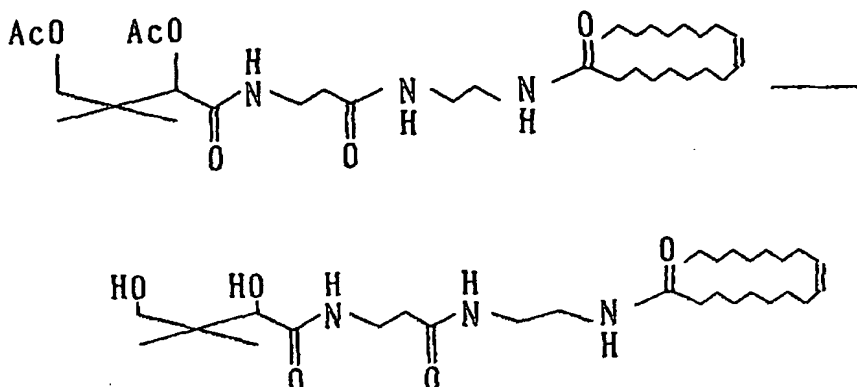
\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 1.05 (3H, s) , 1.09 (3H, s) , 1.10-1.40 (18H, m) , 1.54-2.42 (12H, m) , 2.07 (3H, s) , 2.16 (3H, s) , 3.20-3.60 (6H, m) , 3.86 (1H, d, J=11Hz) , 4.05 (1H, d, J=11Hz) , 4.05 (1H, d, J=11Hz) , 4.86 (1H, s) , 5.30-5.40 (2H, m) , 6.14-6.22 (1H, brs) , 6.52-6.60 (1H, brs) , 7.04-7.12 (1H, brs)

実施例-32

N-(2-N-オレオイルアミノエチル)-3-〔N-

(73)

145  
(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロパンアミド 146



N-(2-N-オレオイルアミノエチル)-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド200mgをメタノール10mlに溶かし、室温攪拌下に1規定カセイソーダ水溶液0.5mlを加え、2時間攪拌した。反応終了後、減圧下で溶媒を留去し、酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物150mg(収率86%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{OH}$ 3324,  $\nu_C$ =1650

質量分析 分子式；C<sub>29</sub>H<sub>53</sub>N<sub>3</sub>O<sub>4</sub>

理論値 507.4011

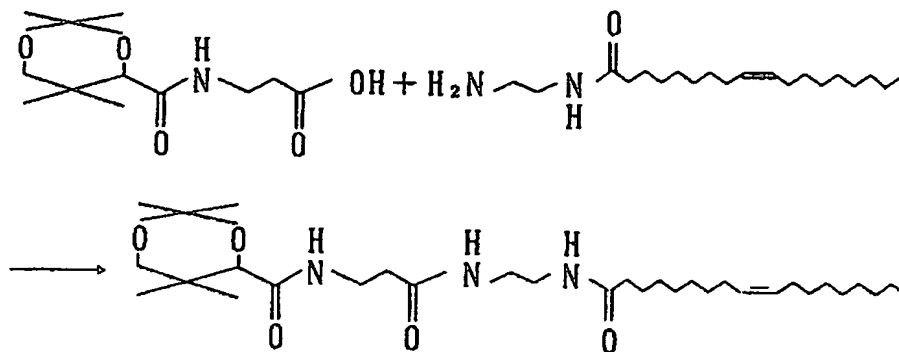
※ 実測値 507.4044

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.94 (3H, s) , 1.00 (3H, s) , 1.16-1.40 (17H, m) , 1.50-1.64 (2H, m) , 1.92-2.08 (4H, m) , 2.19 (2H, t, J=7Hz) , 2.30-2.80 (6H, m) , 3.20-3.54 (6H, m) , 3.62-3.74 (1H, m) , 4.02 (1H, s) , 5.39-5.44 (2H, m) , 6.40-6.50 (1H, m) , 6.96-7.04 (1H, m) , 7.45-7.53 (1H, m)

実施例-33

N-(2-N-オレオイルアミノエチル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

※



N-(2-アミノエチル)オレオイルアミド3.38gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gと塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.58g(収率81%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_C$ =1650

質量分析 分子式；C<sub>32</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 565.4455

実測値 565.4454

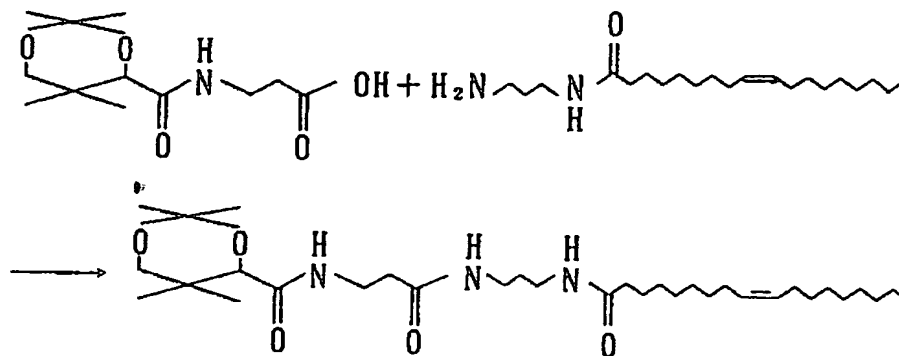
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.23-1.40 (14H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (H, s) , 1.52-1.86 (6H, m) , 1.92-2.10 (4H, m) , 2.18 (2H, t, J=7Hz) , 2.46 (2H, t, J=6Hz) , 3.29 (1H, d, J=12Hz) , 3.38 (3H, brs) , 3.44-3.62 (4H, m) , 3.67 (1H, d, J=12Hz) , 4.08 (1H, s) , 5.30-5.42 (2H, m) , 6.20-6.30 (1H, brs) , 6.65-6.73 (1H, brs) , 6.99-7.08 (1H, brs)

実施例-34

50 N-(3-オレオイルアミノプロピル)-3-[N-

(74)

147  
(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロパンアミド + 148  
\* ボニル) アミノ] プロパンアミド



N-(3-アミノプロピル) オレオイルアミド3.39g  
と3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ  
ン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gと塩  
酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)  
カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、  
一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸  
ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカ  
ゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合  
物2.7g(収率47%)を得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{\text{C=O}}$  1660

質量分析 分子式; C<sub>33</sub>H<sub>61</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 579.4611

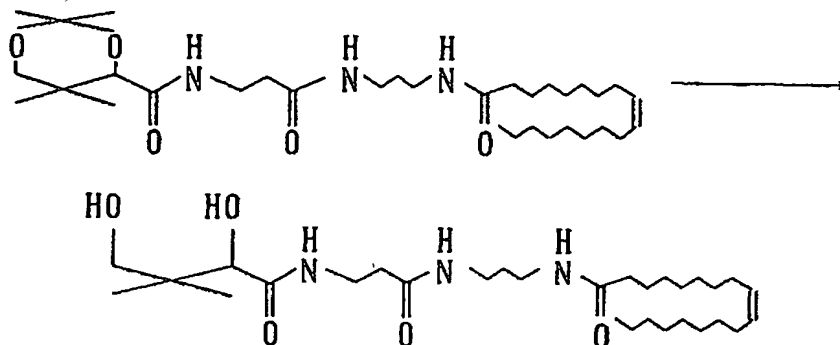
実測値 579.4630

※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz),  
0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.10-1.40  
(20H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
1.54-1.90 (5H, m), 1.90-2.10 (3H, m),  
2.20 (2H, t, J=7Hz), 2.47 (2H, t, J=6Hz),  
3.20-3.36 (5H, m), 3.48-3.66 (2H, m),  
3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 5.30  
- 5.40 (2H, m), 6.15-6.25 (1H, m), 6.58  
- 6.66 (1H, m), 7.02-7.10 (1H, m)

実施例-35

N-(3-オレオイルアミノプロピル) - 3-[N-(  
2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ  
ル) アミノ] プロパンアミド

※



N-(3-オレオイルアミノプロピル) - 3-[N-(  
2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カル  
ボニル) アミノ] プロパンアミド0.58gを酢酸20mlと水1  
0mlの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終  
了後減圧で溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムク  
ロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.48g(収  
率89%)を得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{\text{C=O}}$  1650

質量分析 分子式; C<sub>30</sub>H<sub>57</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 539.4297

実測値 539.4291

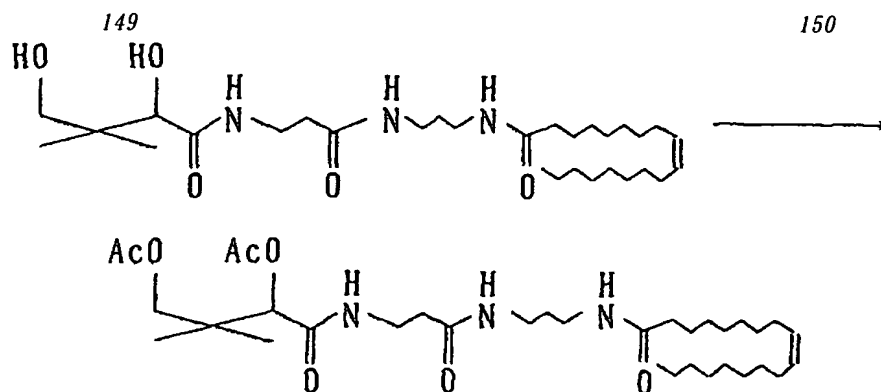
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz),

0.90 (3H, s), 1.01 (3H, s), 1.20-1.40  
(20H, m), 1.55-1.68 (4H, m), 1.92-  
2.08 (4H, m), 2.19 (2H, t, J=6Hz), 2.36-  
2.54 (2H, m), 3.16-3.40 (6H, m), 3.48  
(2H, s), 3.42-3.56 (1H, m), 3.62-3.76  
(1H, m), 4.00 (1H, s), 5.28-5.42 (2H, m),  
6.18-6.24 (1H, m), 6.85-6.94 (1H, m),  
7.42-7.52 (1H, m)

実施例-36

N-(3-オレオイルアミノプロピル) - 3-[N-(  
2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチ  
ル) アミノ] プロパンアミド

(75)



N-(3-オレオイルアミノプロピル)-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド0.54gをピリジン5mlに溶かし無水酢酸10mlを加え一夜攪拌した。反応終了後溶媒を減圧留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.62g(収率99%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{C=O}$  1738, 1658

質量分析 分子式；C<sub>34</sub>H<sub>61</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 623.4508

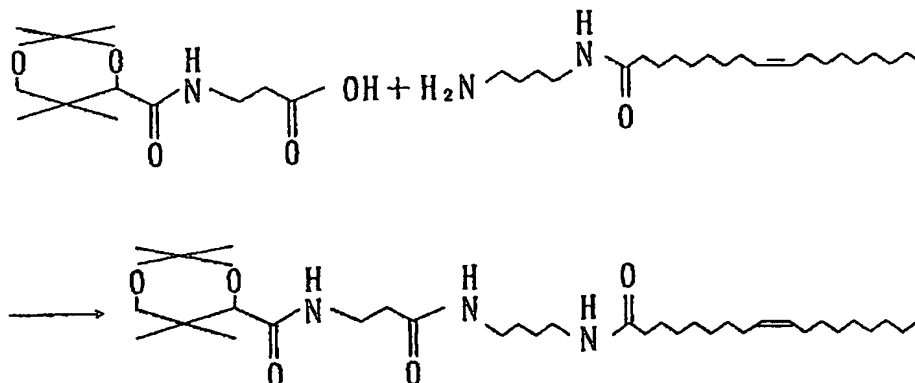
実測値 623.4499

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,

\* 1.04 (3H, s) , 1.08 (3H, s) , 1.16-1.50 (23H, m) , 1.56-1.72 (2H, m) , 1.90-2.06 (2H, m) , 2.07 (3H, s) , 2.15 (3H, s) , 2.19 (2H, t, J=7Hz) , 2.46 (2H, t, J=6Hz) , 2.32-2.48 (2H, m) , 3.16-3.40 (5H, m) , 3.48-3.62 (2H, m) , 3.86 (1H, d, J=11Hz) , 4.03 (1H, s) , 4.90 (1H, s) , 5.28-5.40 (2H, m) , 5.95-6.06 (1H, m) , 6.60-6.70 (1H, m) , 7.18-7.28 (1H, m)

実施例-37

N-(4-オレオイルアミノブチル)-3-[N-(2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド



N-(4-アミノブチル)オレオイルアミド3.77gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gと塩酸1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.66g(収率45%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{C=O}$  1648

質量分析 分子式；C<sub>34</sub>H<sub>63</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 593.4768

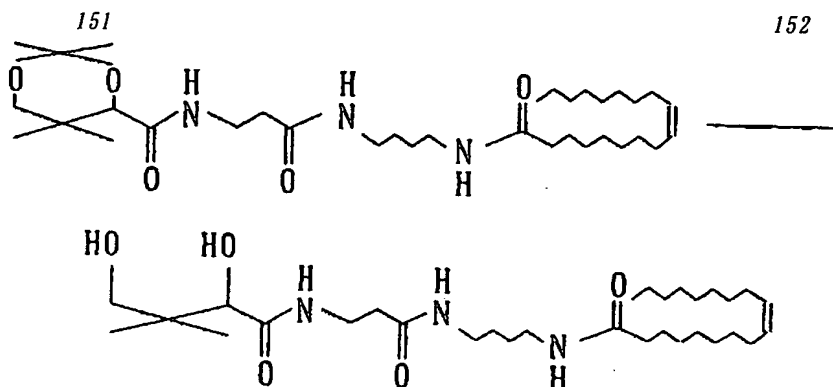
実測値 593.4797

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.40 (18H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 1.50-1.70 (6H, m) , 1.86-2.10 (6H, m) , 2.16 (2H, t, J=8Hz) , 2.45 (2H, t, J=6Hz) , 3.20-3.32 (5H, m) , 3.42-3.66 (2H, m) , 3.69 (1H, d, J=12Hz) , 4.08 (1H, s) , 5.26-5.42 (2H, m) , 5.78-5.86 (1H, m) , 6.35-6.45 (1H, m) , 7.02-7.12 (1H, m)

実施例-38

N-(4-オレオイルアミノブチル)-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド

(76)



N-(4-オレオイルアミノブチル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド1.19gを酢酸20mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし、室温で一晩攪拌した。反応終了後減圧で溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.43g(収率39%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C=O}}$  1650

質量分析 分子式；C<sub>31</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

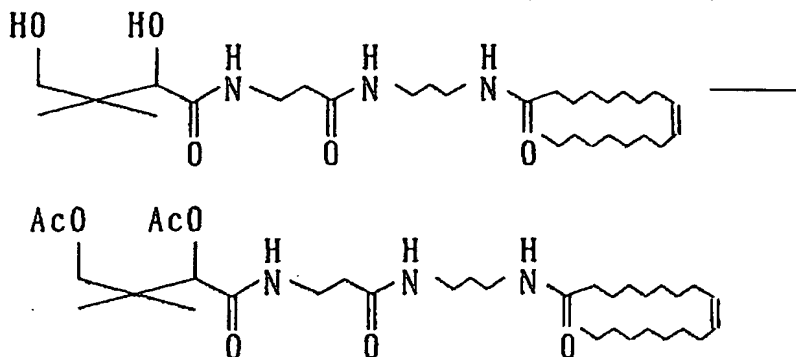
理論値 553.4455

実測値 553.4474

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.95 (3H, s) , 0.99 (3H, s) , 1.18-1.40 (17H, m) , 1.40-1.66 (6H, m) , 1.92-2.10 (4H, m) , 2.18 (2H, t, J=6Hz) , 2.40-2.50 (2H, m) , 2.70-3.32 (6H, m) , 3.32-3.72 (6H, m) , 4.00 (1H, s) , 5.30-5.42 (2H, m) , 6.04-6.10 (1H, m) , 6.60-6.70 (1H, m) , 7.42-7.52 (1H, m)

#### 20 実施例-39

N-4-(オレオイルアミノブチル)-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド



N-(4-オレオイルアミノブチル)-3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロパンアミド0.55gをピリジン5mlに溶かし、無水酢酸10mlを加え一晩攪拌した。反応終了後溶媒を減圧留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.52g(収率82%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C=O}}$  1730, 1650

質量分析 分子式；C<sub>35</sub>H<sub>63</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 637.4566

実測値 637.4584

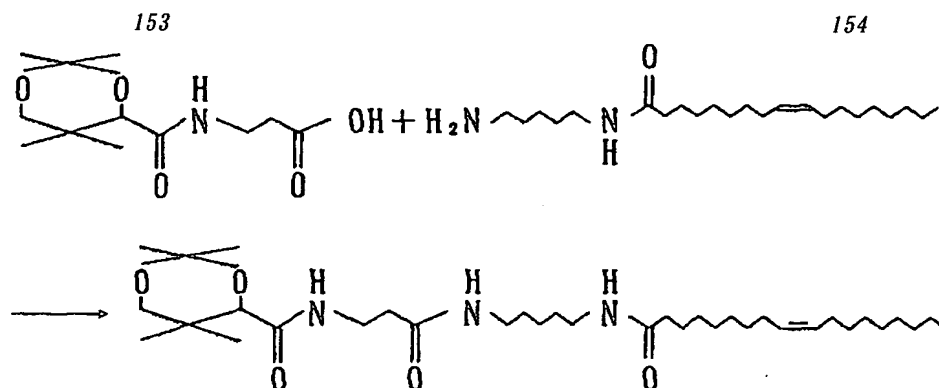
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,

1.03 (3H, s) , 1.07 (3H, s) , 1.20-1.40 (18H, m) , 1.50-1.70 (6H, m) , 1.70-2.10 (6H, m) , 2.07 (3H, s) , 2.16 (3H, s) , 2.16 (2H, t, J=7Hz) , 2.38 (2H, t, J=6Hz) , 3.20-3.30 (4H, m) , 3.42-3.62 (2H, m) , 3.85 (1H, d, J=11Hz) , 4.20 (1H, d, J=11Hz) , 4.93 (1H, s) , 5.30-5.42 (2H, m) , 5.76-5.86 (1H, m) , 6.22-6.30 (1H, m) , 7.00-7.08 (1H, m)

#### 実施例-40

N-(5-オレオイルアミノペンチル)-3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンアミド

(77)



N-(5-アミノペンチル)オレオイルアミド3.66g  
と3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ  
ン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gと塩  
酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)  
カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、  
一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸  
ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカ  
ゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合  
物3.64g (収率60%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C}}=1660$

質量分析 分子式；C<sub>35</sub>H<sub>65</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 607.4923

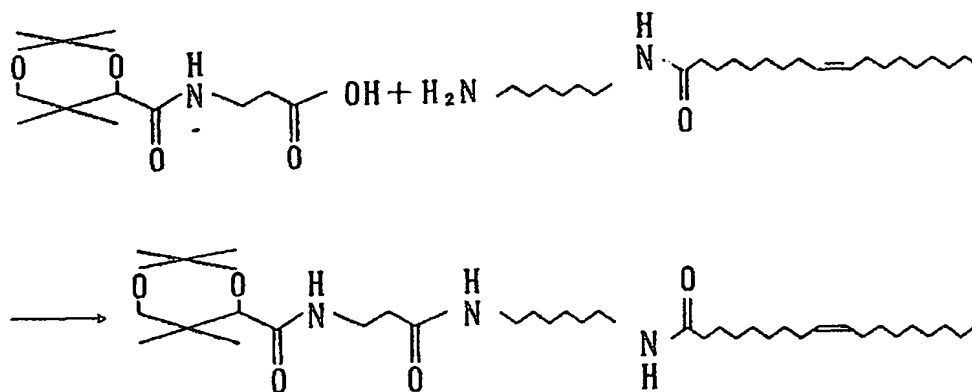
実測値 607.4906

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.74  
(30H, m) , 1.46 (3H, s) , 1.48 (3H, s) ,  
1.90-2.10 (4H, m) , 2.16 (3H, t, J=7Hz) ,  
2.44 (2H, t, J=7Hz) , 3.24 (2H, dt, J=6Hz,  
7Hz) , 3.29 (1H, d, J=12Hz) , 3.44-3.66  
(2H, m) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) , 4.07 (1H,  
s) , 5.32-5.44 (2H, m) , 5.54-5.62 (1H,  
m) , 6.05-6.12 (1H, m) , 6.96-7.08 (1H, m)

実施例-41

N-(6-オレオイルアミノヘキシル)-3-[N-(  
2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ  
ン-4-カル  
ボニル)アミノ]プロパンアミド

\*



N-(6-アミノヘキシル)オレオイルアミド3.81g  
と3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ  
ン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gと塩  
酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)  
カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、  
一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸  
ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカ  
ゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合  
物2.92g (収率47%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C}}=1664, 1644$

質量分析 分子式；C<sub>36</sub>H<sub>67</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 621.5080

実測値 621.5057

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.18-1.76  
(32H, m) , 1.42 (3H, s) , 1.46 (3H, s) ,  
1.92-2.10 (4H, m) , 2.15 (2H, t, J=7Hz) ,  
2.44 (2H, t, J=7Hz) , 3.23 (2H, dt, J=6Hz,  
7Hz) , 3.29 (1H, d, J=12Hz) , 2.44-3.66  
(4H, m) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) , 4.07 (1H,  
s) , 5.30-5.42 (2H, m) , 5.48-5.58 (1H,  
m) , 5.96-6.06 (1H, m) , 7.00-7.06 (1H, m)

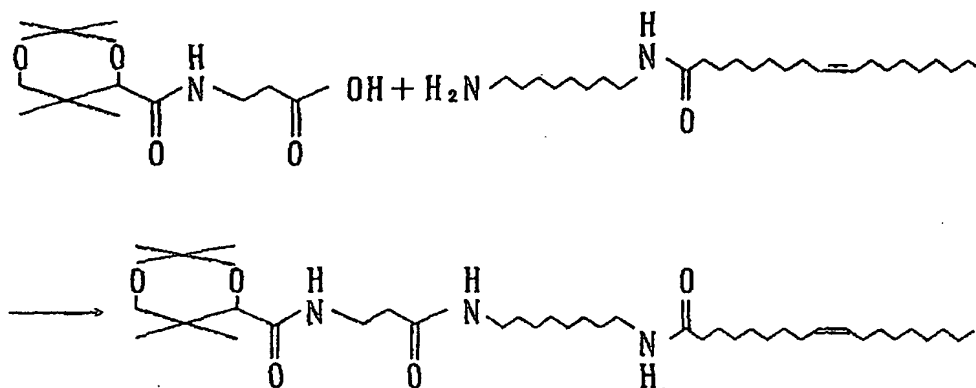
実施例-42

N-(8-オレオイルアミノオクチル)-3-[N-(  
2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ  
ン-4-カル



(78)

155  
ボニル) アミノ] プロパンアミド



N-(8-アミノオクチル) オレオイルアミド4.08g  
と3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ  
ン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gと塩  
酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)  
カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、  
一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸  
ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカ  
ゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合  
物1.36g (収率21%) を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1664, 1644

質量分析 分子式；C<sub>38</sub>H<sub>71</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 649.5392

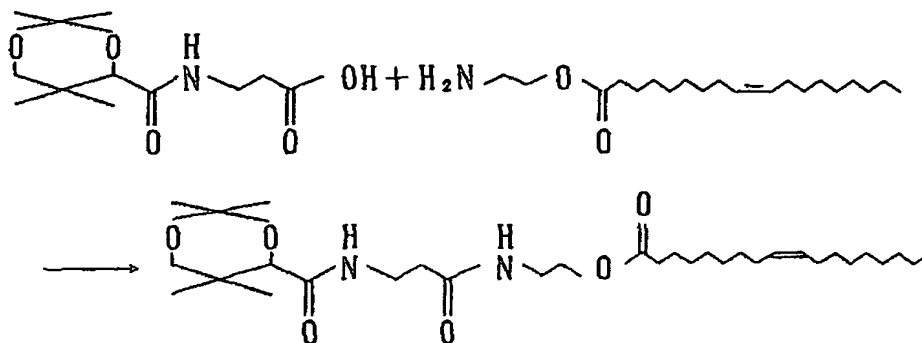
実測値 649.53886

\* NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.40  
(27H, m) , 1.42 (3H, s) , 1.46 (3H, s) ,  
1.56-1.72 (4H, m) , 1.92-2.10 (4H, m) ,  
2.15 (2H, t, J=7Hz) , 2.43 (2H, t, J=7Hz) ,  
3.18-3.26 (5H, m) , 3.28 (1H, d, J=12Hz) ,  
3.44-3.66 (4H, m) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) ,  
4.07 (1H, s) , 5.30-5.40 (2H, m) , 5.40-  
5.48 (1H, m) , 5.86-5.94 (1H, m) , 6.98-  
7.06 (1H, m)

実施例-43

N-(2-オレオイルオキシエチル) -3-[N-(2,  
2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
ル) アミノ] プロパンアミド

\*



2-アミノエチル オレイネート3.26gと3-[N-  
(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カル  
ボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gと塩酸 1-エチ  
ル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミ  
ド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、一夜攪拌し  
た。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウム  
で乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラム  
クロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物1.75g  
(収率31%) を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1742, 1660

質量分析 分子式；C<sub>32</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 566.4294

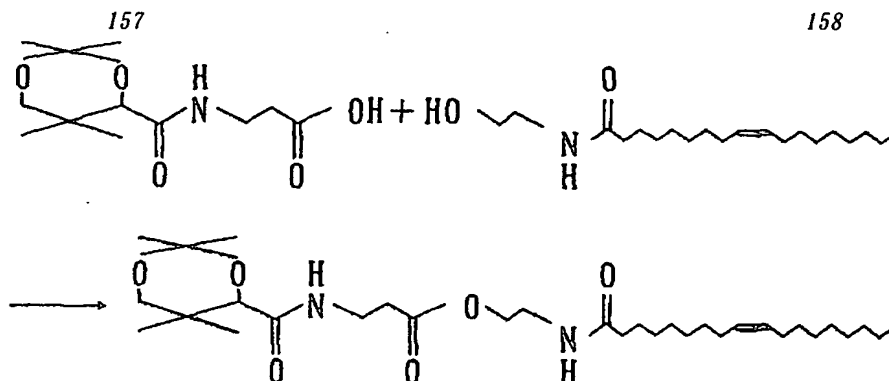
実測値 566.4304

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.97  
(3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.16-1.40 (H, m)  
1.42 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 1.52-1.70 (4H,  
m) , 1.70-1.90 (2H, m) , 1.96-2.08 (2H, m) ,  
2.32 (2H, t, J=7Hz) , 2.46 (2H, t, J=7Hz) ,  
3.29 (1H, d, J=12Hz) , 3.42-3.66 (4H, m) ,  
3.68 (1H, d, J=12Hz) , 4.07 (1H, s) , 4.15  
(2H, t, J=12Hz) , 5.32-5.40 (2H, m) , 6.08-  
6.18 (1H, m) , 6.98-7.08 (1H, m)

実施例-44

2-(N-オレオイルアミノ) エチル 3-[N-(2,  
2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニ  
ル) アミノ] プロピオネート

(79)



N-(2-ヒドロキシエチル)オレオイルアミド0.97 gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸0.78gとジシクロヘキシルカルボジイミド0.61g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン0.36gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物1.50g(収率90%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub>1742, 1658

質量分析 分子式；C<sub>32</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 566.4254

\* 実測値 566.4274

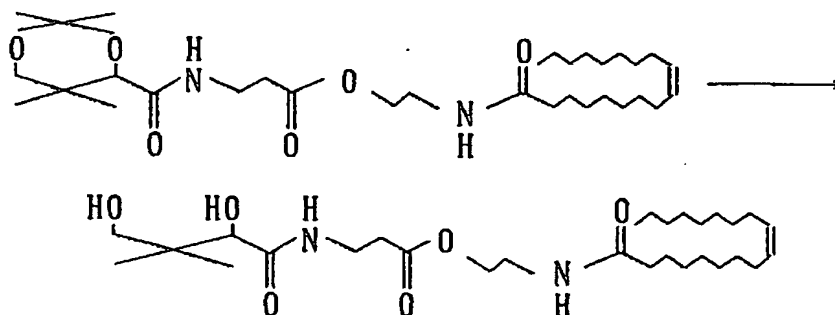
NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
0.98 (3H, s) 、 1.03 (3H, s) 、 1.22-1.38  
(18H, m) 、 1.43 (3H, s) 、 1.47 (3H, s) 、  
1.50-1.72 (5H, m) 、 1.92-2.08 (4H, m) 、  
2.21 (2H, t, J=7Hz) 、 2.56 (2H, t, J=6Hz) 、  
3.29 (1H, d, J=12Hz) 、 3.42-3.70 (4H, m) 、  
3.66 (1H, d, J=12Hz) 、 4.08 (1H, s) 、 4.18  
(1H, s) 、 5.28-5.40 (2H, m) 、 6.27-6.38  
(1H, brs) 、 6.88-6.96 (1H, brs)

20

実施例-45

2-(N-オレオイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

\*



2-(N-オレオイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート880mgを酢酸20mlと水10mlとの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後減圧で溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物740mg(収率91%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>OH</sub>3324, ν<sub>C=O</sub>1740, 1650

質量分析 分子式；C<sub>29</sub>H<sub>54</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 526.3952

実測値 526.3961

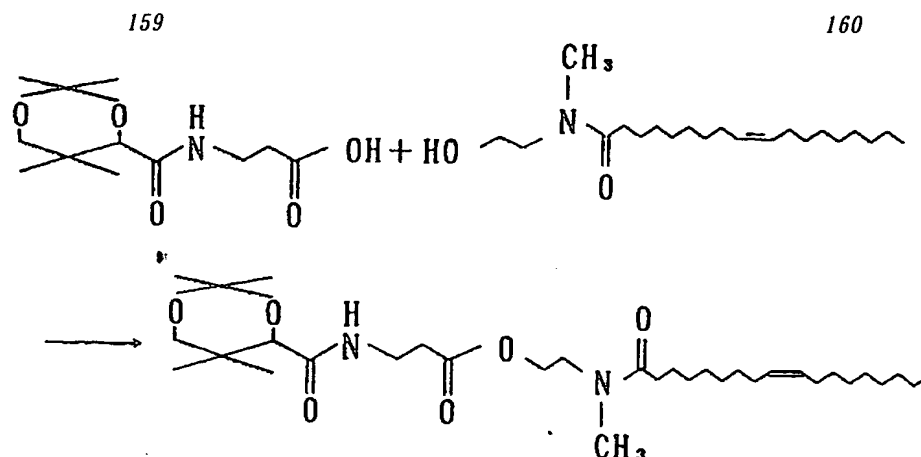
NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) 、  
0.94 (3H, s) 、 1.04 (3H, s) 、 1.20-1.40  
(20H, m) 、 1.52-1.68 (2H, m) 、 1.90-  
2.10 (3H, m) 、 2.20 (2H, t, J=7Hz) 、 2.49-  
2.58 (2H, m) 、 2.80-3.30 (3H, m) 、 3.38-  
3.76 (6H, m) 、 4.02 (1H, s) 、 4.05-5.42 (2H,  
m) 、 6.20-6.30 (1H, brs) 、 7.30-7.40  
(1H, brs)

40

実施例-46

2-(N-メチル-N-オレオイルアミノ)エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

(80)



N-メチル-N-(2-ヒドロキシエチル)オレオイルアミド3.40gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.42g(収率59%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{C=O}$  1740, 1658

質量分析 分子式；C<sub>33</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

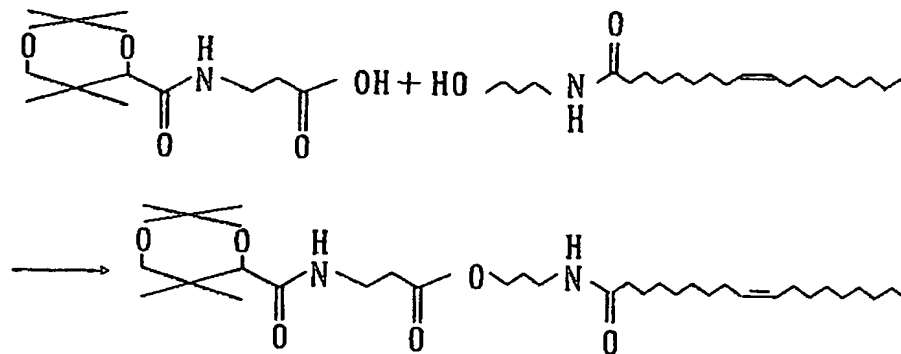
理論値 580.4452

\* 実測値 580.4478

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.22-1.42  
(19H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) ,  
1.55-1.70 (3H, m) , 1.90-2.10 (4H, m) ,  
2.30 (2H, tt, J=7Hz, 7Hz) , 2.52-2.60 (2H,  
m) , 3.05 (3H, s) , 3.29 (1H, d, J=12Hz) ,  
3.42-3.67 (4H, m) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) ,  
4.08 (1H, s) , 4.24 (2H, t, J=7Hz) , 5.30-  
5.42 (2H, m) , 6.98-7.08 (1H, m)

実施例-47

3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート



N-(3-ヒドロキシプロピル)オレオイルアミド3.40gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.52g(収率78%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{C=O}$  1740, 1654

質量分析 分子式；C<sub>33</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 580.4450

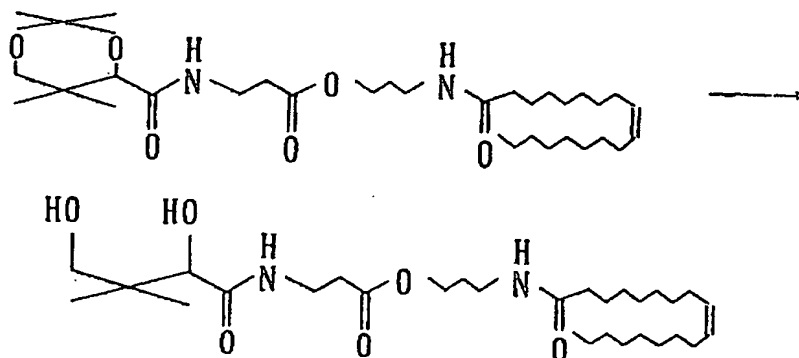
実測値 580.4449

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
0.98 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.10-1.50  
(21H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.46 (3H, s) ,  
1.52-1.86 (2H, m) , 1.84 (2H, tt, J=6Hz,  
7Hz) , 1.90-2.10 (3H, m) , 2.17 (2H, t,  
J=7Hz) , 2.56 (2H, t, J=6Hz) , 3.28 (1H, d,  
J=12Hz) , 3.33 (2H, dd, J=6Hz, 7Hz) ,

(81)

161

3.35-3.60 (2H, m)、3.68 (1H, d, J=12Hz)、  
4.08 (1H, s)、4.15 (2H, t, J=7Hz)、5.28-  
5.42 (2H, m)、5.92-6.02 (1H, brs)、6.90  
- 7.00 (1H, brs)



3-N-オレオイルアミノプロピル 3-[N-(2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート0.58gを酢酸20mlと水10mlの混合溶媒に溶かし、室温で一夜攪拌した。反応終了後減圧で溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.49g (収率90%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1740, 1652

質量分析 分子式；C<sub>30</sub>H<sub>56</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 540.4145

実測値 540.4138

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz),

\* 実施例-48

3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート

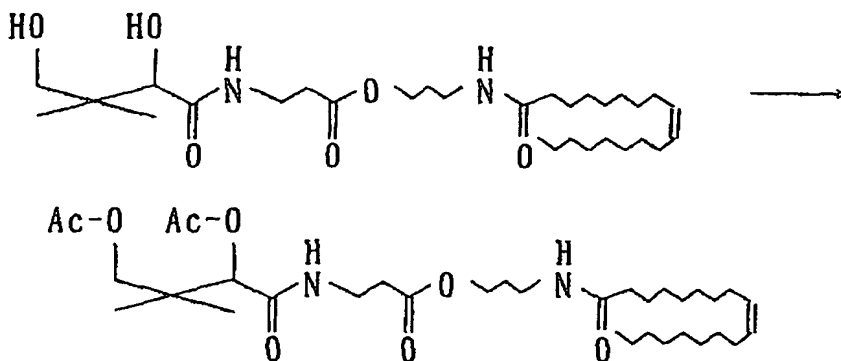
\*

※ 0.93 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.18-1.40 (19H, m), 1.52-1.66 (2H, m), 1.83 (2H, tt, J=6Hz, 7Hz), 1.92-2.06 (4H, m), 2.19 (2H, t, J=6Hz), 2.46-2.72 (2H, m), 3.00-3.56 (8H, m), 3.64-3.76 (1H, m), 3.98-4.10 (1H, m), 4.03 (1H, s), 4.19-4.30 (1H, m), 5.28-5.42 (2H, m), 5.86-5.98 (1H, m), 7.44-7.52 (1H, m)

実施例-49

3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート

※



3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート540mgをピリジン5mlに溶かし、無水酢酸10mlを加え一夜攪拌した。反応終了後溶媒を減圧留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物500mg (収率80%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1740, 1650

質量分析 分子式；C<sub>34</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>8</sub>

理論値 624.4348

実測値 624.4323

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.04 (3H, s), 1.07 (3H, s), 1.15-1.40 (21H, m), 1.55-1.72 (2H, m), 1.84 (2H, tt, J=6Hz, 6Hz), 1.92-2.10 (3H, m), 2.07 (3H, s), 2.15 (3H, s), 2.16 (2H, t, J=7Hz), 2.54 (2H, t, J=6Hz), 3.20-3.68 (4H, m), 3.83 (1H, d, J=11Hz), 4.09 (1H, d, J=11Hz), 4.12 (2H, d, J=6Hz), 4.93 (1H, s), 5.30-5.38 (2H, m), 5.92-6.02 (1H, m), 6.70-6.80 (1H, m)

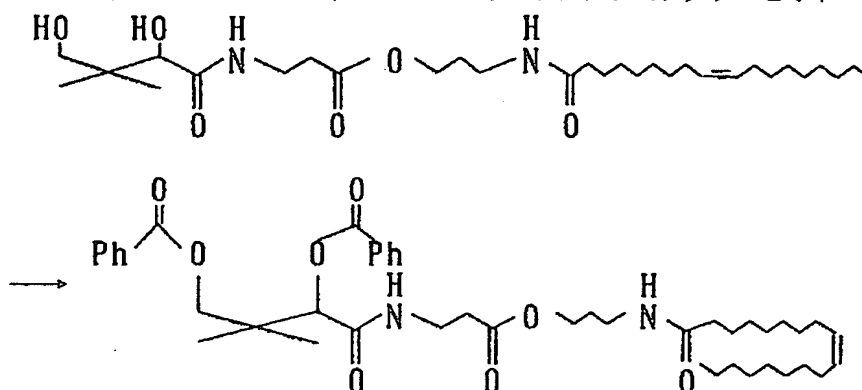
(82)

163

164

## 実施例-50

3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-

\*(2,4-ジベンゾイルオキシ-3,3-ジメチル-1-オキソ  
ソブチル)アミノ]プロピオネート

3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート270mgをピリジン5mlに溶かし、塩化ベンゾイル281mgを加え一夜攪拌した。反応終了後溶媒を減圧留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物260mg(収率69%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub>1722, 1650質量分析 分子式；C<sub>44</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>8</sub>

理論値 748.4662

実測値 748.4673

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,

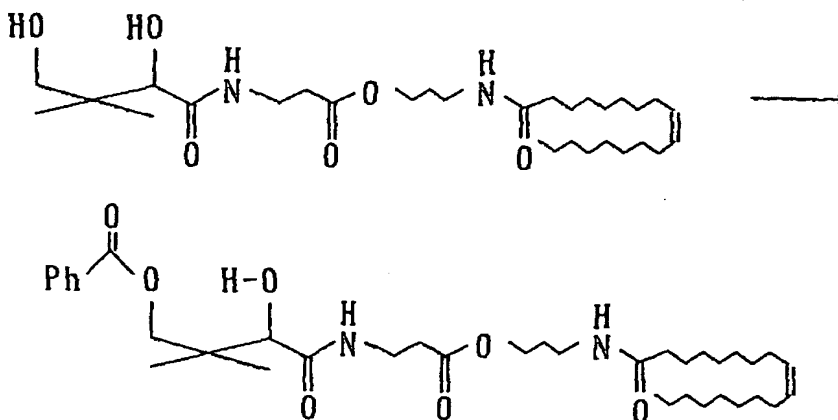
※ 1.20-1.40 (25H, m) , 1.52-1.64 (2H, m) ,  
1.76 (2H, tt, J=6Hz, 7Hz) , 1.92-2.06 (4H, m) , 2.11 (2H, t, J=7Hz) , 2.51 (2H, t, J=6Hz) , 3.18-3.40 (2H, m) , 3.40-3.66 (2H, m) , 4.02 (2H, t, J=6Hz) , 4.28 (1H, d, J=10Hz) , 4.33 (1H, d, J=10Hz) , 5.30 - 5.40 (2H, m) , 5.82-5.92 (1H, m) , 6.78 - 6.86 (1H, m) , 7.40-7.50 (4H, m) , 7.52 - 7.64 (2H, m) , 8.00-8.10 (4H, m)

20

## 実施例-51

3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(4-ベンゾイルオキシ-2-ヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート

※



3-(N-オレオイルアミノ)プロピル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオネート540mgをピリジン5mlに溶かし、塩化ベンゾイル140mgを加え一夜攪拌した。反応終了後溶媒を減圧留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物318mg(収率51%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub>1740, 1720, 1660質量分析 分子式；C<sub>37</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 628.4449

実測値 628.4423

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
1.06 (3H, s) , 1.18 (3H, s) , 1.16-1.40 (17H, m) , 1.48-1.62 (2H, m) , 1.62-1.70 (3H, m) , 1.81 (2H, tt, J=7Hz, 7Hz) , 1.92-2.08 (3H, m) , 2.11 (3H, t, J=7Hz) , 2.42-2.70 (2H, m) , 3.18-3.30 (1H, m) , 3.34-3.48 (2H, m) , 3.64-3.76 (1H, m) , 4.00-4.05 (2H, m) , 4.12 (1H, d, J=12Hz) , 4.14-4.24 (1H, m) , 4.38 (1H, d, J=12Hz) , 4.64-4.68 (1H, brs) , 5.28-5.40 (2H, m) , 5.72-5.82 (1H, brs) , 7.30-7.38 (1H, m) , 7.44 (2H, dd, J=7Hz, 7Hz) , 7.56 (1H, dd,

50

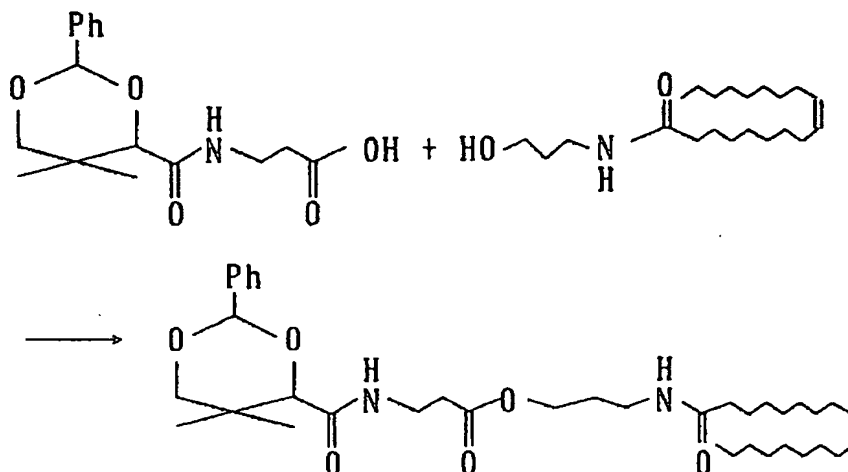
(83)

165

J = 7Hz, 7Hz), 8.05 (2H, d, J = 7Hz)

実施例-52

3-N-オレオイルアミノプロピル 3-[N-(2-\*



N-(3-ヒドロキシプロピル)オレオイルアミド3.40gと3-[N-(2-フェニル-5,5-ジメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸3.07gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物5.34g(収率85%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1738, 1662質量分析 分子式；C<sub>37</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 628.4452

実測値 628.4465

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J = 7Hz),

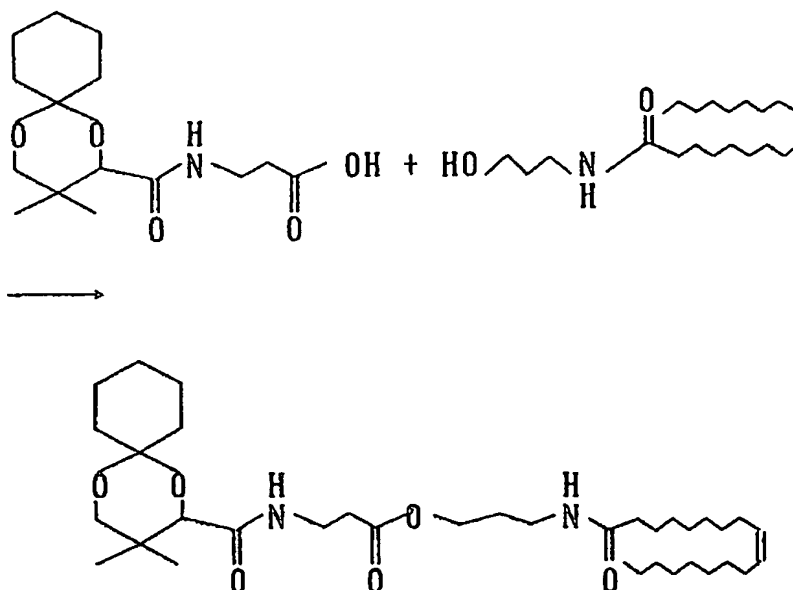
166

\* フェニル-5,5-ジメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

1.11 (3H, s), 1.20 (3H, s), 1.22-1.43 (13H, m), 1.52-1.72 (6H, m), 1.77 (2H, tt, J = 7Hz, 7Hz), 1.90-2.06 (4H, m), 2.14 (2H, tt, J = 7Hz, 7Hz), 2.38 (2H, t, J = 7Hz), 2.52 (2H, t, J = 7Hz), 3.26 (1H, dt, J = 6Hz, 7Hz), 3.46-3.62 (4H, m), 3.69 (1H, d, J = 12Hz), 4.10 (1H, t, J = 7Hz), 4.11 (1H, s), 5.30-5.42 (2H, m), 5.52 (1H, s), 5.82-5.92 (1H, m), 6.90-7.04 (1H, m), 7.38-7.44 (3H, m), 7.48-7.53 (2H, m)

実施例-53

30 3-N-オレオイルアミノプロピル 3-[N-(3,3-ジメチル-1,5-ジオキサスピロ[5,5]ウンデカン-3-カルボニル)アミノ]プロピオネート



(84)

167

N-(3-ヒドロキシプロピル) オレオイルアミド3.40gと3-[N-(3,3-ジメチル-1,5-ジオキサスピロ[5,5]ウンデカン-3-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.99gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物5.46g(収率88%)を得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{\text{C=O}}$  1740, 1652質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

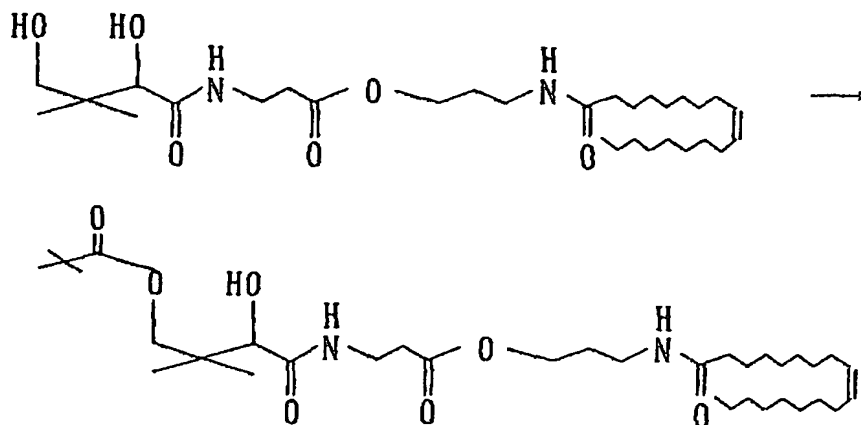
理論値 620.4763

\* 実測値 620.4761

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.22-2.10 (36H, m), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.56 (2H, t, J=6Hz), 3.26 (1H, d, J=12Hz), 3.32 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz), 3.50-3.68 (4H, m), 3.71 (1H, d, J=12Hz), 4.10 (1H, s), 4.15 (2H, t, J=7Hz), 5.28-5.40 (2H, m), 5.90-5.98 (1H, m), 6.98-7.10 (1H, m)

10 実施例-54

3-(N-オレオイルアミノ) プロピル 3-[N-(2-ヒドロキシ-3,3-ジメチル-4-(トリメチルアセチル) オキシ-1-オキソブチル) アミノ] プロピオネート



3-(N-オレオイルアミノ) プロピル 3-[N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) アミノ] プロピオネート540mgをピリジン5mlに溶かし、塩化ビバロイル220mgを加え一夜攪拌した。反応終了後溶媒を減圧留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物139mg(収率2%)を得た。

性状; 油状

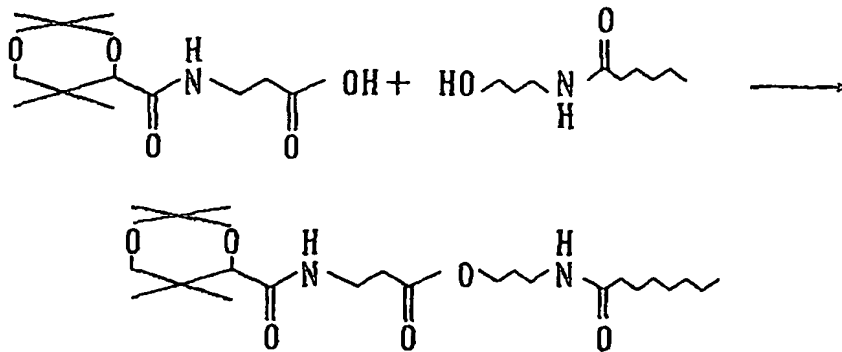
IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{\text{C=O}}$  1740, 1660NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz),

1.20-1.38 (25H, m), 1.59 (9H, s), 1.52

※ - 1.70 (2H, m), 1.85 (2H, tt, J=7Hz, 7Hz), 1.94-2.06 (6H, m), 2.17 (2H, t, 7Hz), 2.56 (2H, t, J=7Hz), 3.28-3.40 (2H, m), 3.54-3.62 (2H, m), 4.07 (1H, d, J=12Hz), 4.10-4.20 (2H, m), 4.68 (1H, d, J=12Hz), 5.11 (1H, s), 5.28-5.40 (2H, m), 5.70 - 5.80 (1H, m), 6.94-7.02 (1H, m)

実施例-55

3-(N-ヘキサノイルアミノ) プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート



N-(3-ヒドロキシプロピル) ヘキサノアミド1.75 gと3-[N-2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ

(85)

169

ン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物1.90g(収率46%)を得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{\text{C=O}}$  1740, 1658

質量分析 分子式; C<sub>21</sub>H<sub>38</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 414.2730

実測値 414.2741

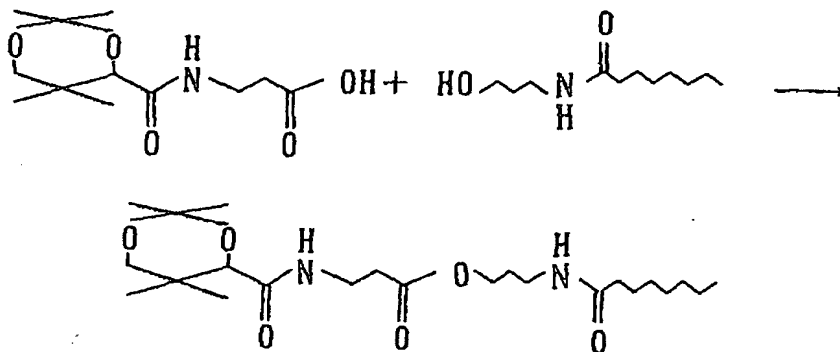
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.90 (3H, t, J=7Hz),

170

\* 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.22-1.36 (3H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.58-1.74 (1H, m), 1.85 (2H, tt, 7Hz, 7Hz), 2.18 (2H, t, J=7Hz), 2.56 (2H, t, J=7Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.33 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz), 3.46-3.66 (4H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.16 (2H, t, J=12Hz), 5.94-6.02 (1H, m), 6.92-7.04 (1H, m)

10 実施例-56

3-(N-オクタイルアミノ) プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート



N-(3-ヒドロキシプロピル) オクタンアミド2.03gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.56gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.91g(収率66%)を得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{\text{C=O}}$  1738, 1658

質量分析 分子式; C<sub>23</sub>H<sub>42</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

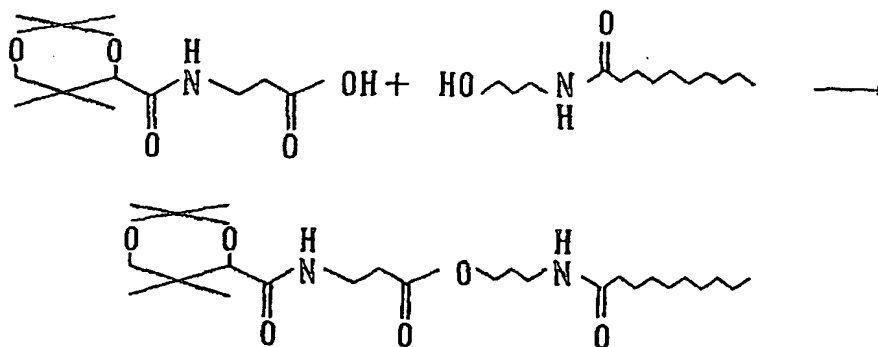
理論値 442.3043

実測値 442.3054

※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.20-1.36 (5H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.56-1.74 (3H, m), 1.84 (2H, tt, J=7Hz, 7Hz), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.56 (2H, t, J=7Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.33 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz), 3.46-3.66 (4H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.15 (2H, t, J=7Hz), 5.94-6.02 (1H, m), 6.92-7.04 (1H, m)

実施例-57

3-(N-デカノイルアミノ) プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート



N-(3-ヒドロキシプロピル) デカンアミド2.29g 50 と3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ



(86)

171

ン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59g, ジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.61g (収率98%) を得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1740, 1662

質量分析 分子式; C<sub>25</sub>H<sub>46</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 470.3356

実測値 470.3377

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz),

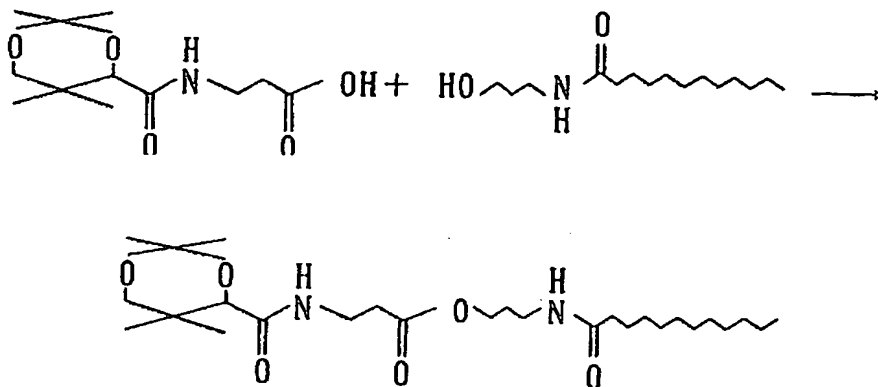
172

\* 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.20-1.34 (6H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.56-1.78 (4H, m), 1.82-1.94 (3H, m), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.36-2.44 (1H, m), 2.56 (2H, t, J=7Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.33 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz), 3.46-3.66 (4H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.15 (2H, t, J=12Hz), 5.92-6.02 (1H, m), 6.08-6.18 (1H, m), 6.92-7.07 (1H, m)

10 実施例-58

3-(N-ドデカノイルアミノ) プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

\*



N-(3-ヒドロキシプロピル) ドデカンアミド2.57gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.19g (収率64%) を得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1738, 1660

質量分析 分子式; C<sub>27</sub>H<sub>50</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 498.3668

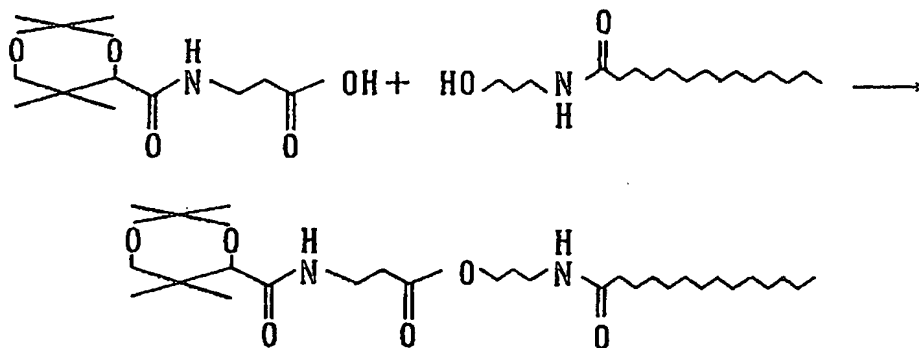
実測値 498.3676

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.18-1.36 (7H, m), 1.41 (3H, s), 1.45 (3H, s), 1.56-1.76 (6H, m), 1.78-1.94 (4H, m), 2.16 (2H, t, J=7Hz), 2.36-2.42 (2H, m), 2.55 (2H, t, J=7Hz), 3.28 (1H, d, J=7Hz), 3.31 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz), 3.44-3.65 (4H, m), 3.67 (1H, d, J=12Hz), 4.06 (1H, s), 4.14 (2H, t, J=7Hz), 5.96-6.02 (1H, m), 6.90-7.04 (1H, m)

実施例-59

3-(N-テトラデカノイルアミノ) プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

40



(87)

173

N-(3-ヒドロキシプロピル) テトラデカンアミド 2.87gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.63g(収率88%)を得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{\text{C}}=1740, 1656$ 質量分析 分子式; C<sub>29</sub>H<sub>54</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 526.3981

実測値 526.3983

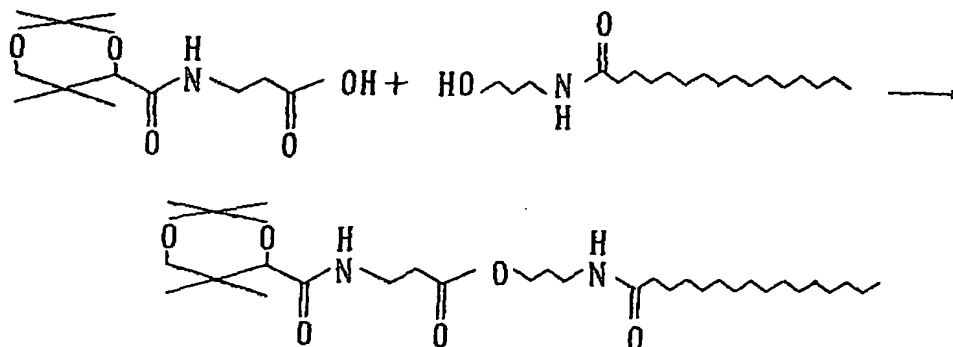
174

\*NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.20-1.34 (15H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.52-1.64 (4H, m), 1.84 (2H, tt, J=7Hz, 7Hz), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.36-2.44 (1H, m), 2.56 (2H, t, J=7Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.33 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz), 3.48-3.66 (4H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.16 (2H, t, J=7Hz), 5.92 - 5.96 (1H, m), 6.90-7.02 (1H, m)

実施例-60

3-(N-ヘキサデカノイルアミノ) プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

\*



実測値 554.4301

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.21-1.36 (22H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.56-1.98 (6H, m), 1.84 (2H, tt, J=7Hz, 7Hz), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.56 (2H, t, J=7Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.32 (2H, dd, J=7Hz, 6Hz), 3.67 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.16 (2H, t, J=12Hz), 5.92-5.98 (1H, m), 6.92-7.04 (1H, m)

実施例-61

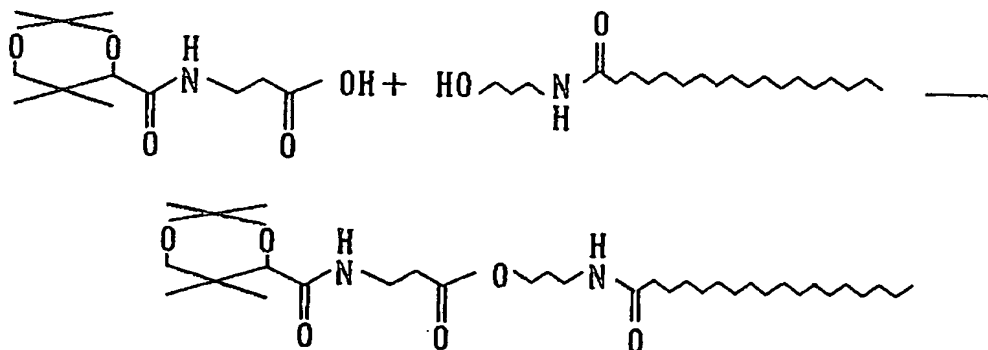
3-(N-オクタデカノイルアミノ) プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

N-(3-ヒドロキシプロピル) ヘキサデカンアミド 3.13gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物5.48g(収率99%)を得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{\text{C}}=1740, 1658$ 質量分析 分子式; C<sub>31</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 554.4294



(88)

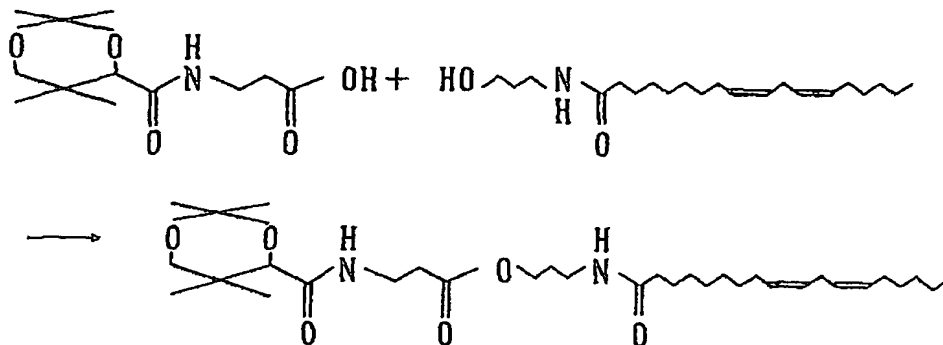
175

N-(3-ヒドロキシプロピル) オクタデカンアミド 3.42gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.90g(収率67%)を得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1738, 1652質量分析 分子式; C<sub>33</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 582.4608



N-(3-ヒドロキシプロピル) リノレオイルアミド 3.38gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物を収率67%で得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1740, 1654質量分析 分子式; C<sub>33</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 578.4294

実測値 578.4291

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.89 (3H, t, J=7Hz),

176

\* 実測値 582.4619

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.20-1.36 (17H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.54-1.96 (10H, m), 2.17 (3H, t, J=7Hz), 2.56 (2H, t, J=7Hz), 3.28 (1H, t, J=12Hz), 3.33 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz), 3.44-3.62 (4H, m), 3.67 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.16 (2H, t, J=7Hz), 5.96-6.02 (1H, m), 6.92-7.04 (1H, m)

実施例-62

3-(N-リノレオイルアミノ) プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

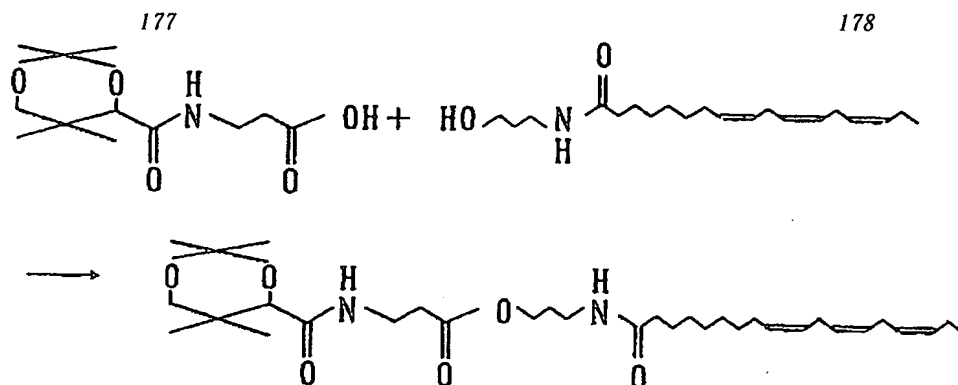
0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.20-1.44 (17H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.52-1.76 (4H, m), 1.84 (2H, tt, J=7Hz, 7Hz), 2.00-2.10 (6H, m), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.36-2.44 (1H, m), 2.56 (2H, t, J=7Hz), 2.77 (2H, t, J=7Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.32 (2H, dd, J=6Hz, 7Hz), 3.46-3.64 (4H, m), 3.67 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.16 (2H, t, J=12Hz), 5.28-5.42 (1H, m), 5.92-6.00 (1H, m), 6.94-7.02 (1H, m)

実施例-63

3-(N-リノレノイルアミノ) プロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

40

(89)



N-(3-ヒドロキシプロピル)リノレニルアミド3.35gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、精製し、標記化合物4.09g(収率71%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1738, 1652

質量分析 分子式；C<sub>33</sub>H<sub>56</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 576.4138

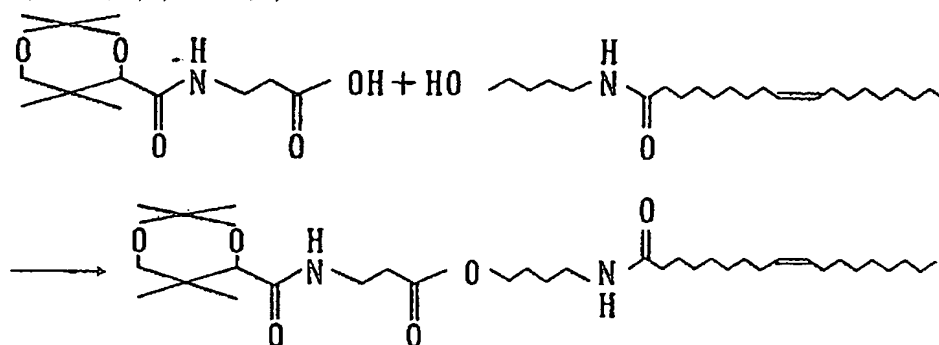
実測値 576.4126

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.97 (3H, t, J=7Hz) ,

\* 0.98 (3H, s) , 1.05 (3H, s) , 1.26-1.44 (12H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.46 (3H, s) , 1.53-1.74 (6H, m) , 1.80-1.92 (4H, m) , 2.02-2.10 (2H, m) , 2.17 (2H, t, J=7Hz) , 2.34-2.42 (2H, m) , 2.56 (2H, t, J=7Hz) , 3.29 (1H, d, J=12Hz) , 2.74-2.86 (2H, m) , 3.28 (1H, d, J=12Hz) , 3.32 (2H, dd, J=6Hz, 7Hz) , 3.42-3.66 (4H, m) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) , 4.07 (1H, s) , 4.15 (2H, t, J=12Hz) , 5.26-5.44 (6H, m) , 5.90-6.00 (1H, m) , 6.92-7.06 (1H, m)

実施例-64

4-(N-オレオイルアミノ)ブチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート



N-(4-ヒドロキシブチル)オレオイルアミド3.54gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し、精製し、標記化合物5.05g(収率85%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ; ν<sub>C=O</sub> 1740, 1662

質量分析 分子式；C<sub>34</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 594.4608

実測値 594.4618

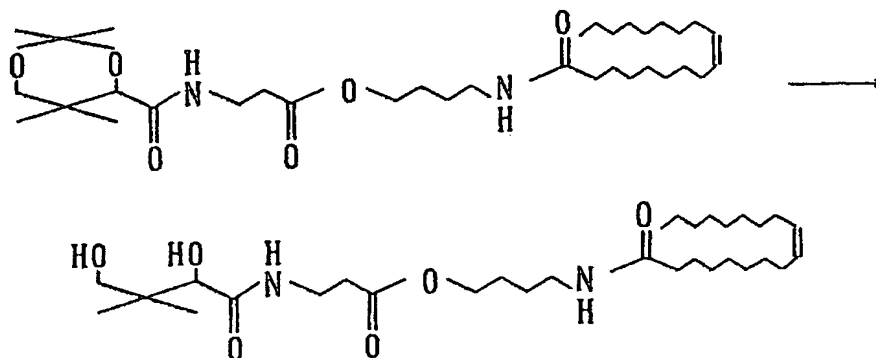
40 NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.40 (23H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) , 1.50-1.80 (6H, m) , 1.86-2.10 (3H, m) , 2.17 (2H, dt, J=6Hz, 7Hz) , 2.56 (2H, t, J=6Hz) , 3.28 (1H, d, J=12Hz) , 3.40-3.66 (2H, m) , 3.69 (1H, d, J=12Hz) , 4.08 (1H, s) , 4.12 (2H, t, J=6Hz) , 5.30-5.40 (2H, m) , 5.48-5.56 (1H, m) , 6.90-7.00 (1H, m)

実施例-65

50 4-(N-オレオイルアミノ)ブチル 3-[N-(2,

(90)

179  
4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル) \* \* アミノ) プロピオネート 180



4-(N-オレオイルアミノ)ブチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート0.59gを酢酸20mlと水10mlの混合溶媒に溶かし、室温で一晩攪拌した。反応終了後減圧で溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物0.50g(収率91%)を得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1740, 1658

質量分析 分子式; C<sub>31</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

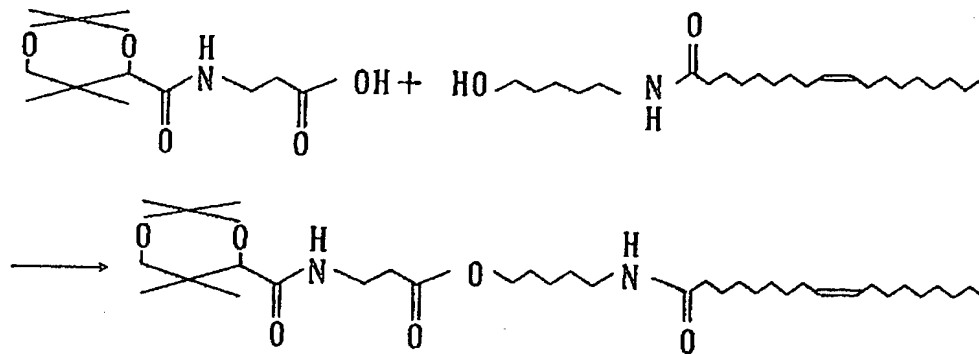
理論値 554.4293

実測値 554.4291

※NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.94 (3H, s), 1.01 (3H, s), 1.18-1.42 (21H, m), 1.50-1.80 (6H, m), 1.90-2.12 (3H, m), 2.18 (2H, t, J=7Hz), 2.45-2.57 (2H, m), 3.10-3.80 (8H, m), 4.02 (1H, m), 4.05-4.13 (1H, m), 4.18-4.26 (1H, m), 5.30-5.41 (2H, m), 5.88-5.96 (1H, m), 7.34-7.44 (1H, m)

実施例-66

5-(N-オレオイルアミノ)ペンチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート



N-(5-ヒドロキシペンチル)オレオイルアミド3.68gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.99g(収率82%)を得た。

性状; 油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{C=O}$  1738, 1658

質量分析 分子式; C<sub>35</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 608.4764

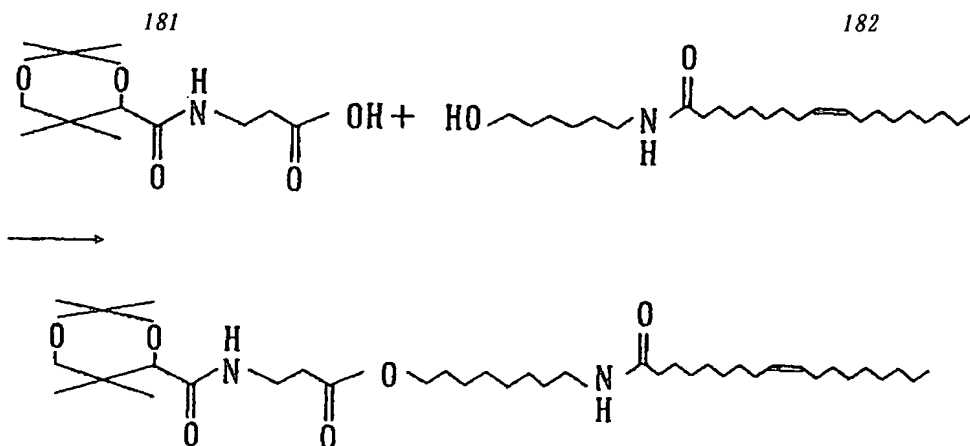
実測値 608.4764

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.20-1.80 (26H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.84-2.10 (4H, m), 2.15 (2H, t, J=6Hz), 2.56 (2H, t, J=6Hz), 3.25 (1H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.40-3.68 (4H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.10 (2H, t, J=12Hz), 5.30-5.40 (2H, m), 5.48-5.54 (1H, m), 6.90-7.02 (1H, m)

実施例-67

5-(N-オレオイルアミノ)ヘキシル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサネ-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

(91)



N-(6-ヒドロキシヘキシル)オレオイルアミド3.82gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C}}=1740, 1656$

質量分析 分子式；C<sub>36</sub>H<sub>66</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 622.4920

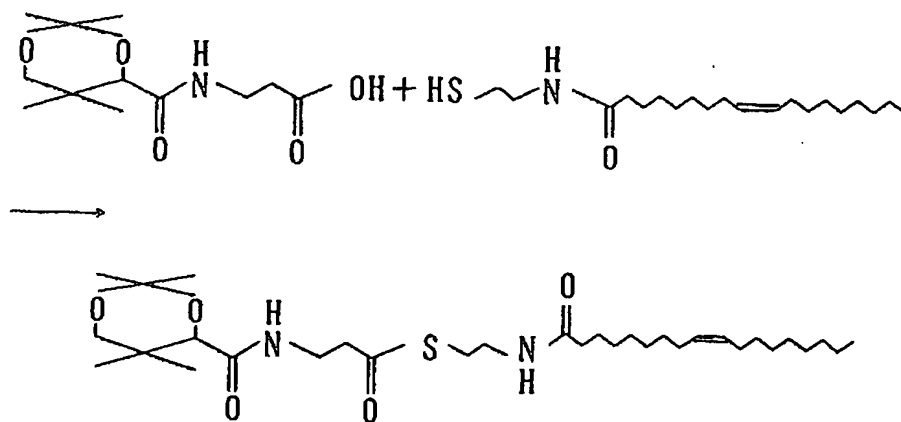
実測値 633.4923

\* NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.97 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.54 (24H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) , 1.56-1.70 (6H, m) , 1.90-2.10 (4H, m) , 2.15 (2H, t, J=7Hz) , 2.55 (2H, t, J=6Hz) , 3.24 (1H, dt, J=6Hz, 6Hz) , 3.29 (1H, d, J=12Hz) , 3.40-3.66 (2H, m) , 3.68 (1H, d, J=12Hz) , 4.08 (1H, s) , 4.09 (2H, t, J=6Hz) , 5.30-5.40 (2H, m) , 5.40-5.50 (1H, m) , 6.92-7.02 (1H, m)

実施例-68

S-[2-(N-オレオイルアミノ)エチル] 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロパンチオエート

\*



N-(2-メルカプトエチル)オレオイルアミド3.42gと3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈殿物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物4.77g (収率82%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{\text{C}}=1730, 1656$

質量分析 分子式；C<sub>32</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S

理論値 582.4123

実測値 582.4095

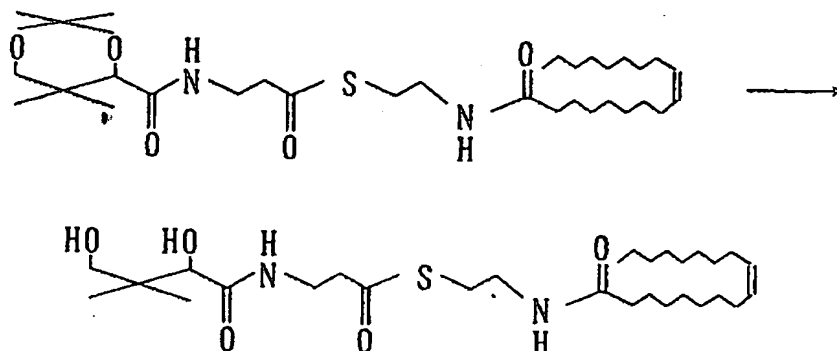
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) , 0.98 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.20-1.40 (19H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) , 1.58-1.70 (2H, m) , 1.84-2.10 (4H, m) , 2.17 (2H, t, J=7Hz) , 2.78-2.86 (2H, m) , 3.05 (2H, t, J=6Hz) , 3.29 (1H, d, J=12Hz) , 3.35-3.62 (5H, m) , 3.67 (1H, d, J=12Hz) ,

(92)

183

4.07 (1H, s), 5.34-5.41 (2H, m), 5.93  
- 6.02 (1H, m), 6.83-6.92 (1H, m)

実施例-69



S-〔2-(N-オレオイルアミノ)エチル〕3-  
〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-  
カルボニル)アミノ〕プロパンチオエート0.58gを酢  
酸20mlと水10mlの混合溶媒に溶かし、室温で一  
夜攪拌した。反応終了後減圧で溶媒を留去し、残  
留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに  
供し精製し、標記化合物0.16g(収率29%)を得た。

性状；油状

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{\text{C=O}}$  1650質量分析 分子式; C<sub>29</sub>H<sub>54</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S

理論値 542.3753

実測値 542.3765

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz),

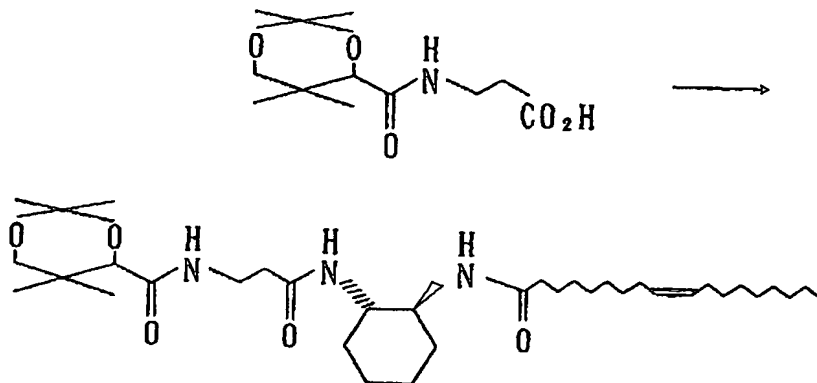
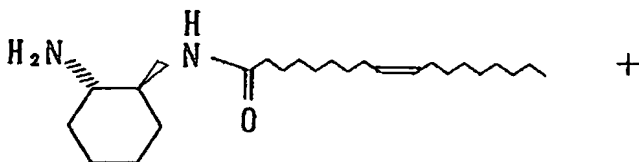
184

\* S-〔2-(N-オレオイルアミノ)エチル〕3-  
〔N-(2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキ  
ソブチル)アミノ〕プロパンチオエート

※ 0.93 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.15-1.40  
(16H, m), 1.50-1.70 (2H, m), 1.90-  
2.06 (4H, m), 2.17 (2H, t, J=8Hz), 2.25  
- 2.60 (6H, m), 2.70-2.80 (1H, m), 2.82  
- 2.98 (2H, m), 3.05-3.15 (1H, m), 3.30  
- 3.52 (6H, m), 4.01 (1H, s), 5.30-5.42  
(2H, m), 5.90-6.00 (1H, brs), 7.22-  
7.32 (1H, brs)

実施例-70

N-〔(1S, 2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロ  
ヘキサン-1-イル〕-3-〔N-(2,2,5,5-テトラ  
メチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕  
プロパンアミド



3-N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン  
-4-カルボニル)アミノ〕プロピオン酸745mg, N-  
(2-アミノシクロヘキシル)オレオイルアミド800mg  
と塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピ  
ル)カルボジイミドgとを塩化メチレン50mlに溶かし、  
一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸  
ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物を、シリ

カゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化  
合物504mg(収率34%)を得た。

性状；油状

旋光度 [ $\alpha$ ]<sub>D</sub>; -15.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_{\text{C=O}}$  1660, 1642質量分析 分子式; C<sub>36</sub>H<sub>65</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

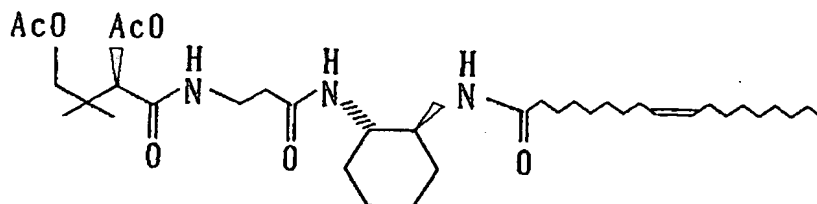
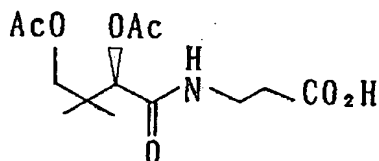
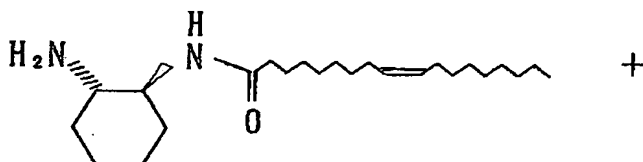
理論値 619.4924

(93)

185

実測値 619.4913

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) : 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),  
 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.15-1.37  
 (24H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
 1.50-1.62 (2H, m), 1.68-1.82 (2H, m),  
 1.90-2.08 (6H, m), 2.11 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),  
 2.28-2.44 (2H, m), 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ),  
 3.36-3.48 (1H, m), 3.55-3.68 (3H, m),



3-N-[(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル]アミノ]プロピオン酸187mgと  
 (1S,2S)-N-(2-アミノシクロヘキシル)オレオ  
 イルアミド172mgと塩酸 1-エチル-3-(3-ジメ  
 チルアミノプロピル)カルボジイミドgとを塩化メチ  
 レン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を  
 水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去し  
 た。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供  
 し精製し、標記化合物194mg(収率56%)を得た。

性状; 油状

旋光度 [ $\alpha$ ]  $D$ ; -3.10° (C=1.0,  $\text{CHCl}_3$ )IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat);  $\nu_{\text{C=O}}$  1750, 1660質量分析 分子式;  $\text{C}_{36}\text{H}_{65}\text{N}_3\text{O}_7$ 

理論値 663.4822

実測値 663.4833

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) : 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),

186

\* 3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 4.08 (1H, d,  $J=11$   
 Hz), 5.29-5.40 (2H, m), 5.84 (1H, brs),  
 6.38 (1H, brs), 7.00 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ )

実施例-71

N-[(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘ  
 キサン-1-イル]-3-[N-[(2R)-2,4-ジア  
 セトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル]アミ  
 ノ]プロパンアミド

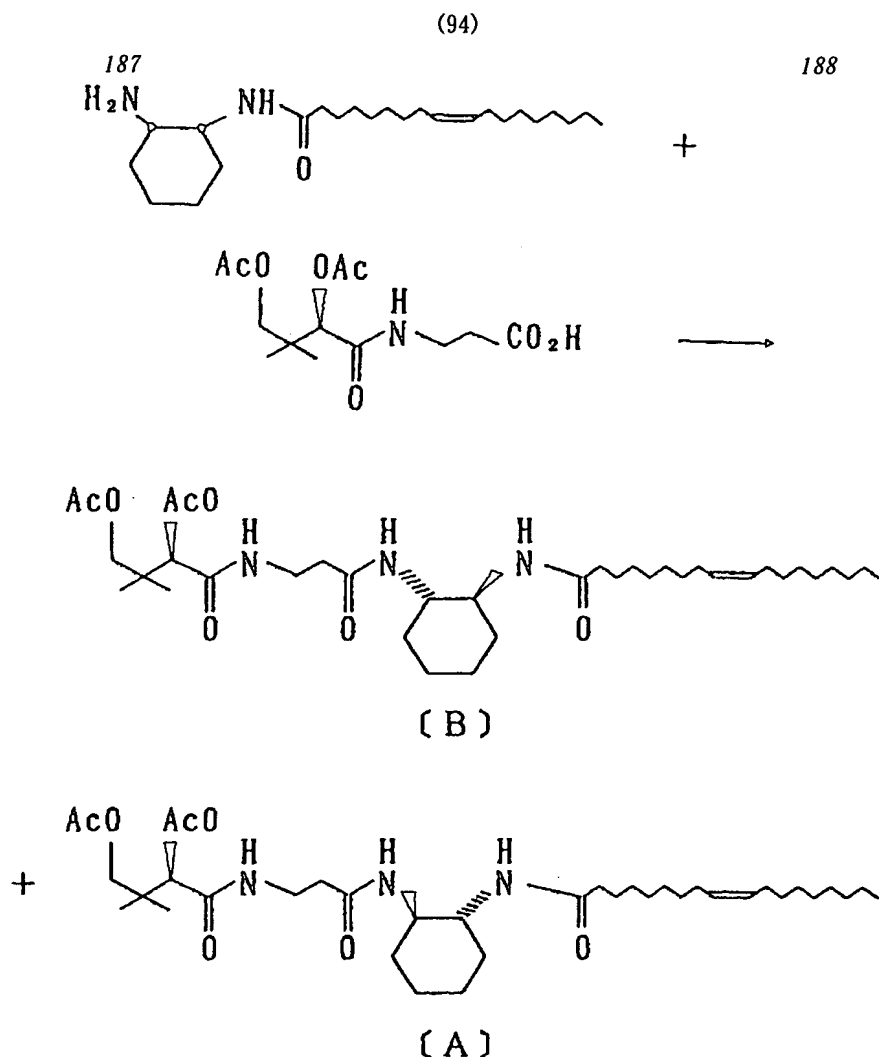
1.03 (3H, s), 1.08 (3H, s), 1.18-1.39  
 (24H, m), 1.07-1.83 (2H, m), 1.92-  
 2.09 (6H, m), 2.08 (3H, s), 2.14 (2H, t,  
 $J=7\text{Hz}$ ), 2.20 (3H, s), 2.32 (2H, t,  $J=7$   
 Hz), 3.28-3.40 (1H, m), 3.49-3.59 (2H,  
 m), 3.61-3.74 (1H, m), 3.82 (1H, d,  $J=$   
 12Hz), 4.04 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 4.09 (1H,  
 s), 5.29-5.40 (2H, m), 5.79 (1H, d,  $J=$   
 8Hz), 6.19 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 7.03 (1H,  
 t,  $J=6\text{Hz}$ )

実施例-72

N-[2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-  
 イル]-3-[N-[(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-  
 ジメチル-1-オキソブチル]アミノ]プロパンアミ  
 ド

40





3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル)アミノ]プロピオン酸1.01gとN-(2-アミノシクロヘキシル)オレオイルアミド1.26gと塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物に2種のジアステレオマーA〔N-〔(1R,2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル〕-3-[N-〔(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル〕アミノ]プロパンアミド〕及びB〔N-〔(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル〕-3-[N-〔(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル〕アミノ]プロパンアミド〕を各々603mg(収率28%)及び714mg(収率33%)を得た。

A

性状；油状

旋光度〔α〕<sub>D</sub>；-32.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)；ν<sub>C=O</sub>1750, 1660

質量分析 分子式；C<sub>37</sub>H<sub>65</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 663.4822

実測値 663.4834

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.08 (3H, s), 1.10 (3H, s), 1.21-1.38 (24H, m), 1.46-1.65 (2H, m), 1.69-1.79 (2H, m), 1.88-2.08 (6H, m), 2.08 (3H, s), 2.13 (2H, t, J=7Hz), 2.14-2.26 (1H, m), 2.16 (3H, s), 2.23-2.42 (1H, m), 3.06-3.16 (1H, m), 3.56-3.79 (3H, m), 3.90 (1H, d, J=11Hz), 4.07 (1H, d, J=11Hz), 4.80 (1H, s), 5.29-5.42 (1H, m), 5.69 (1H, d, J=8Hz), 6.56 (1H, d, J=8Hz), 7.41 (1H, t, J=6Hz)

B

性状；油状

旋光度〔α〕<sub>D</sub>；-3.10° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)；ν<sub>C=O</sub>1750, 1660

質量分析 分子式；C<sub>37</sub>H<sub>65</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 663.4822

実測値 663.4833

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.03 (3H, s), 1.08 (3H, s), 1.18-1.39

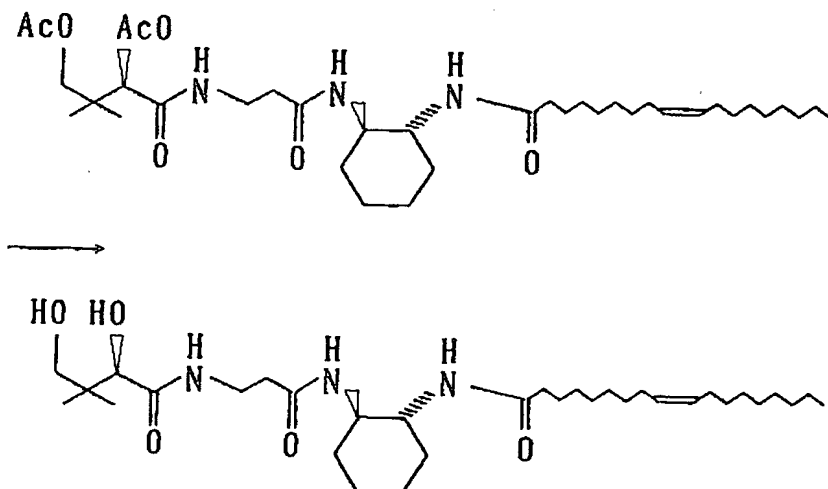
(95)

189  
(24H, m), 1.07-1.83 (2H, m), 1.92-2.09 (6H, m), 2.08 (3H, s), 2.14 (2H, t, J=7Hz), 2.20 (3H, s), 2.32 (2H, t, J=7Hz), 3.28-3.40 (1H, m), 3.49-3.59 (2H, m), 3.61-3.74 (1H, m), 3.82 (1H, d, J=12Hz), 4.04 (1H, d, J=12Hz), 4.09 (1H, s), 5.29-5.40 (2H, m), 5.79 (1H, d, J=8Hz),

190  
\* 6.19 (1H, d, J=8Hz), 7.03 (1H, t, J=6Hz)

## 実施例-73

N-[(1R, 2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル]-3-[N-{(2R)-2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル}アミノ]プロパンアミド



N-[(1R, 2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル]-3-[N-{(2R)-2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル}アミノ]プロパンアミド380mgメタノール10mlに溶かし、室温攪拌下に1規定カセイソーダ水溶液0.5mlを加え、2時間攪拌した。反応終了後、減圧下で溶媒を留去し、酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物293mg (収率89%)を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D$ ; +34.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat);  $\nu_C$ =1642

質量分析 分子式; C<sub>33</sub>H<sub>61</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

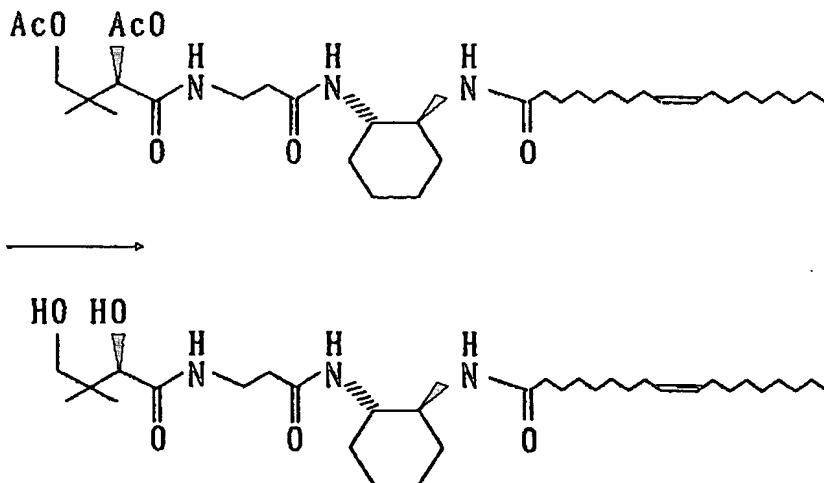
理論値 579.4611

実測値 579.4596

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>); 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.95 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.17-1.38 (24H, m), 1.49-1.62 (2H, m), 1.73-1.82 (2H, m), 1.93-2.08 (6H, m), 2.14 (2H, t, J=7Hz), 2.31-2.45 (2H, m), 2.52-2.86 (2H, m), 3.44-3.73 (6H, m), 3.98 (1H, s), 5.28-5.40 (2H, m), 6.08 (1H, brs), 6.63 (1H, brs), 7.34 (1H, t, J=6Hz)

## 実施例-74

N-[(1S, 2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル]-3-[N-{(2R)-2,4-ジヒドロキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル}アミノ]プロパンアミド



(96)

191

N-〔(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル〕-3-〔N-〔(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキシブチル〕アミノ〕プロパンアミド485mgメタノール10mlに溶かし、室温攪拌下に1規定カセイソーダ水溶液0.5mlを加え、2時間攪拌した。反応終了後、減圧下で溶媒を留去し、酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物410mg(収率97%)を得た。

性状；油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ； $-0.60^\circ$  (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)； $\nu_{\text{C}}=1644$

質量分析 分子式；C<sub>33</sub>H<sub>61</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

理論値 579.4611

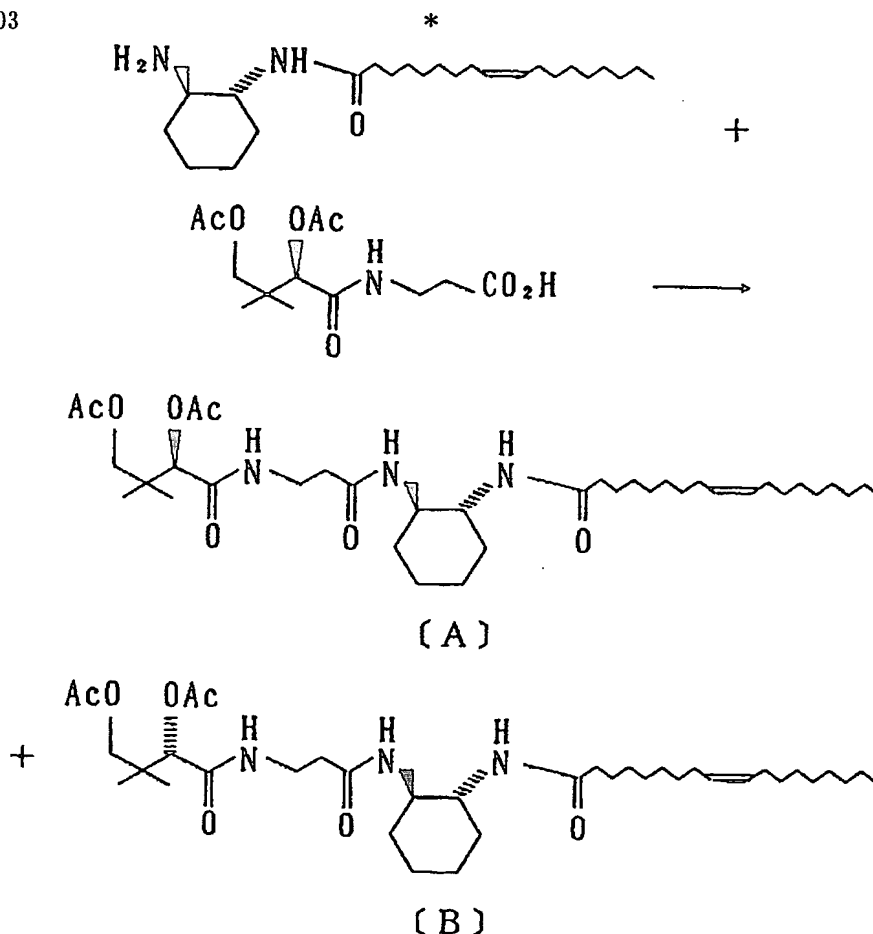
実測値 579.4603

192

\*NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>)；0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.94 (3H, s), 1.05 (3H, s), 1.16-1.38 (24H, m), 1.46-1.62 (2H, m), 1.71-1.82 (2H, m), 1.87-2.07 (6H, m), 2.12 (2H, t, J=7Hz), 2.32-2.44 (1H, m), 2.48-2.58 (1H, m), 2.63-3.05 (2H, m), 3.18-3.29 (1H, m), 3.46 (1H, d, J=11Hz), 3.51 (1H, d, J=11Hz), 3.55-3.73 (2H, m), 3.86-3.99 (1H, m), 4.12 (1H, s), 5.29-5.41 (2H, m), 5.99 (1H, d, J=8Hz), 7.02 (1H, d, J=8Hz), 7.11-7.19 (1H, m)

実施例-75

N-〔2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル〕-3-〔N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキシブチル)アミノ〕プロパンアミド



dl-3-〔N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキシブチル)アミノ〕プロピオン酸1.51gと(1R,2R)-N-(2-アミノシクロヘキシル)オレオイルアミド1.90gと塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド1.91gとを塩化メチレン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供

し精製し、標記化合物に2種のジアステレオマーA〔N-(1R,2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル〕-3-〔N-〔(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキシブチル〕アミノ〕プロパンアミド〕及びB〔N-(1R,2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル〕-3-〔N-〔(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキシブチル〕アミノ〕プロパンアミドを各々848mg(収

(97)

193

率28%)及び1.00g(収率33%)を得た。

〔A〕

性状;油状

旋光度 $[\alpha]_D$ ;  $-32.0^\circ$  ( $C=1.0, \text{CHCl}_3$ )IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat);  $\nu_{\text{C=O}}$  1750, 1660質量分析 分子式;  $\text{C}_{37}\text{H}_{65}\text{N}_3\text{O}_7$ 

理論値 663.4822

実測値 663.4834

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ); 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),  
 1.08 (3H, s), 1.10 (3H, s), 1.21-1.38  
 (24H, m), 1.46-1.65 (2H, m), 1.69-  
 1.79 (2H, m), 1.88-2.08 (6H, m), 2.08  
 (3H, s), 2.13 (2H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 2.14-  
 2.26 (1H, m), 2.16 (3H, s), 2.23-2.42  
 (1H, m), 3.06-3.16 (1H, m), 3.56-3.79  
 (3H, m), 3.90 (1H, d,  $J=11\text{Hz}$ ), 4.07  
 (1H, d,  $J=11\text{Hz}$ ), 4.80 (1H, s), 5.29-5.42  
 (1H, m), 5.69 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.56 (1H, d,  
 $J=8\text{Hz}$ ), 7.41 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ )

〔B〕

性状;油状

194

\* 旋光度 $[\alpha]_D$ ;  $+2.04^\circ$  ( $C=1.0, \text{CHCl}_3$ )IR ( $\text{cm}^{-1}$ , neat);  $\nu_{\text{C=O}}$  1750, 1660質量分析 分子式;  $\text{C}_{37}\text{H}_{65}\text{N}_3\text{O}_7$ 

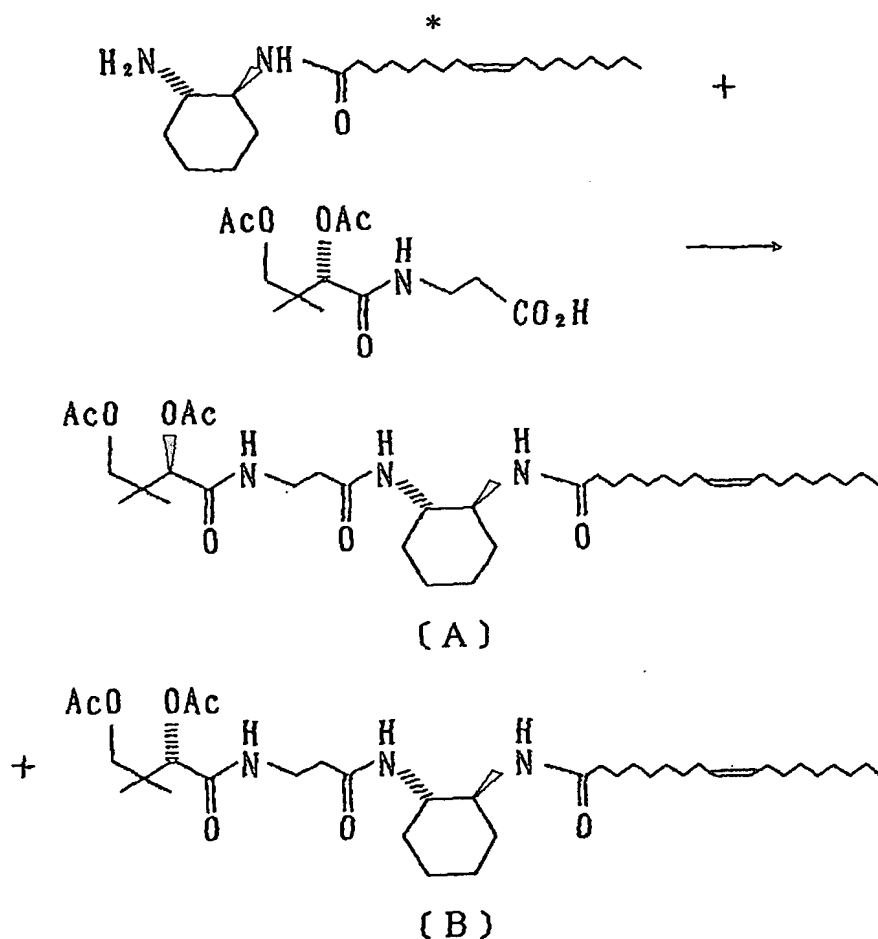
理論値 663.4822

実測値 663.4833

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ); 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ),  
 1.03 (3H, s), 1.08 (3H, s), 1.18-1.39  
 (24H, m), 1.07-1.83 (2H, m), 1.92-  
 2.09 (6H, m), 2.08 (3H, s), 2.14 (2H, t,  
 $J=7\text{Hz}$ ), 2.20 (3H, s), 2.32 (2H, t,  $J=7$   
 Hz), 3.28-3.40 (1H, m), 3.49-3.59  
 (2H, m), 3.61-3.74 (1H, m), 3.82 (1H,  
 d,  $J=12\text{Hz}$ ), 4.04 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 4.09  
 (1H, s), 5.29-5.40 (2H, m), 5.79 (1H, d,  
 $J=8\text{Hz}$ ), 6.19 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 7.03 (1H, t,  
 $J=6\text{Hz}$ )

実施例-76

N-[2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-  
 イル]-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチ  
 ル-1-オキシプロピル)アミノ]プロパンアミド



d1-3-[N-(2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチ  
 ル-1-オキシプロピル)アミノ]プロピオン酸1.44gと(1  
 S, 2S)-N-(2-アミノシクロヘキシル)オレオイル

アミド] 1.80gと塩酸 1-エチル-3-(3-ジメチ  
 ルアミノプロピル)カルボジイミド1.91gとを塩化メチ  
 レン50mlに溶かし、一夜攪拌した。反応終了後、反応液

(98)

195

を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、溶媒を留去した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物に2種のジアステレオマーA〔N-(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル〕-3-〔N-{(2R)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル}アミノ〕プロパンアミド〕及びB〔N-{(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル}-3-〔N-{(2S)-2,4-ジアセトキシ-3,3-ジメチル-1-オキソブチル}アミノ〕プロパンアミド〕を各859mg (収率29%)及び0.80g (収率27%)を得た。

〔B〕

性状；油状

旋光度〔α〕<sub>D</sub>；-32.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat)；ν<sub>C</sub>=1750, 1660質量分析 分子式；C<sub>37</sub>H<sub>65</sub>N<sub>3</sub>O<sub>7</sub>

理論値 663.4822

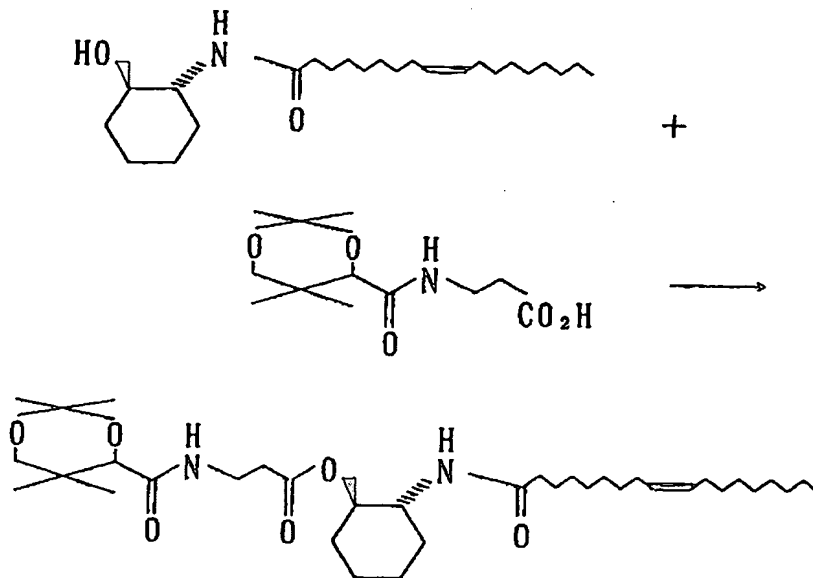
196

\* 実測値 663.4834

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.08 (3H, s), 1.10 (3H, s), 1.21-1.38 (24H, m), 1.46-1.65 (2H, m), 1.69-1.79 (2H, m), 1.88-2.08 (6H, m), 2.08 (3H, s), 2.13 (2H, t, J=7Hz), 2.14-2.26 (1H, m), 2.16 (3H, s), 2.23-2.42 (1H, m), 3.06-3.16 (1H, m), 3.56-3.79 (3H, m), 3.90 (1H, d, J=11Hz), 4.07 (1H, d, J=11Hz), 4.80 (1H, s), 5.29-5.42 (1H, m), 5.69 (1H, d, J=8Hz), 6.56 (1H, d, J=8Hz), 7.41 (1H, t, J=6Hz)

実施例-77

(1R,2R)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート



(1R,2R)-2-(N-オレオイルアミノ)シクロヘキサノール3.79gと3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈澱物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.27g (収率53%)を得た。

性状；油状

旋光度〔α〕<sub>D</sub>；+26.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (cm<sup>-1</sup>, neat)；ν<sub>C</sub>=1736, 1654質量分析 分子式；C<sub>36</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 620.4764

実測値 620.4759

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.99 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.07-1.39 (24H, m), 1.43 (3H, s), 1.48 (3H, s), 1.50-1.83 (4H, m), 1.92-2.17 (6H, m), 2.10 (2H, t, J=7Hz), 2.51 (2H, t, J=6Hz), 3.32-3.43 (1H, m), 3.57-3.68 (1H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.83-3.95 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.64 (1H, td, J=11Hz, 5Hz), 5.28-5.40 (1H, m), 5.74 (1H, d, J=8Hz), 6.95 (1H, t, J=6Hz)

実施例-78

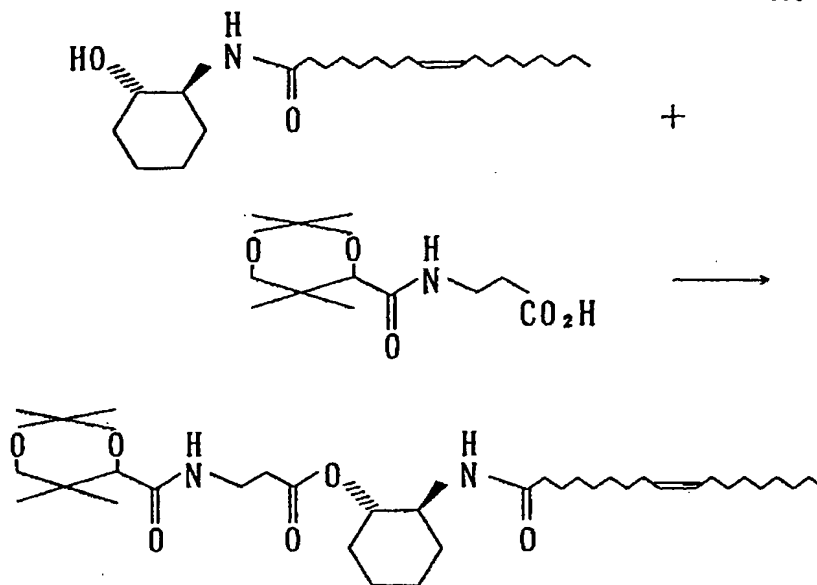
(1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロヘキサン-1-イル 3-〔N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ〕プロピオネート

50 ト

(99)

197

198



(1S,2S) - 2 - (N-オレオイルアミノ) シクロヘキサノール3.79gと3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4 - (N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈澱物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物3.52g (収率57%) を得た。

性状；油状

旋光度〔α〕<sub>D</sub>；+14.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat)；ν<sub>C=O</sub>1734, 1654

質量分析 分子式；C<sub>36</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

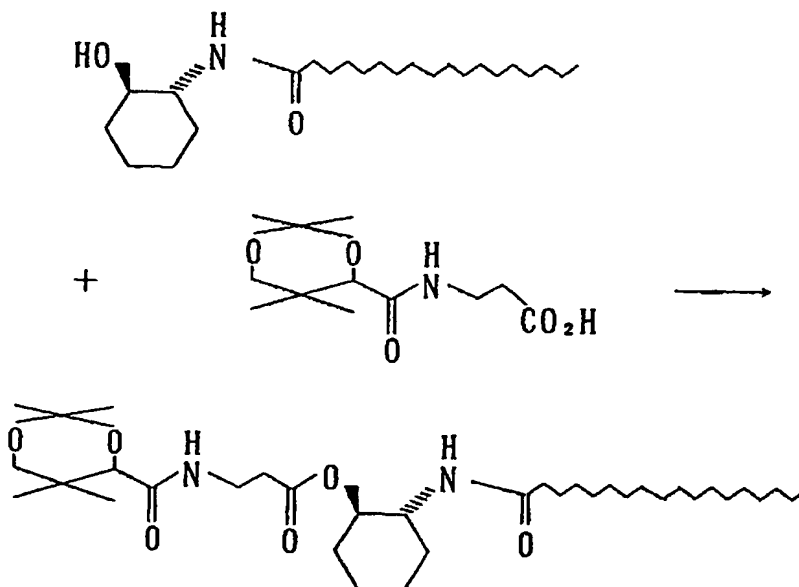
理論値 620.4764

実測値 620.4777

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
0.96 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.06-1.38  
(24H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) ,  
1.48-1.80 (4H, m) , 1.92-2.17 (6H, m) ,  
2.10 (2H, t, J=7Hz) , 2.51 (2H, t, J=6Hz) ,  
3.28 (1H, d, J=12Hz) , 3.45-3.57 (2H, m) ,  
3.69 (1H, d, J=12Hz) , 3.82-3.93 (1H, m) ,  
4.08 (1H, s) , 4.64 (1H, td, J=11Hz, 5Hz) ,  
5.79 (1H, d, J=8Hz) , 6.91 (1H, t, J=6Hz)

実施例-79

(1R,2R) - 2 - (ステアロイルアミノ) シクロヘキサン-1-イル 3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート



(100)

199

(1R,2R) - 2 - (N-ステアロイルアミノ) シクロヘキサノール3.81gと3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4 - (N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈澱物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.82g (収率45%) を得た。

性状；融点69.1~70.2℃

旋光度  $[\alpha]_D$  ; +25.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{C=O}$  1734, 1660, 1646

質量分析 分子式；C<sub>36</sub>H<sub>66</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

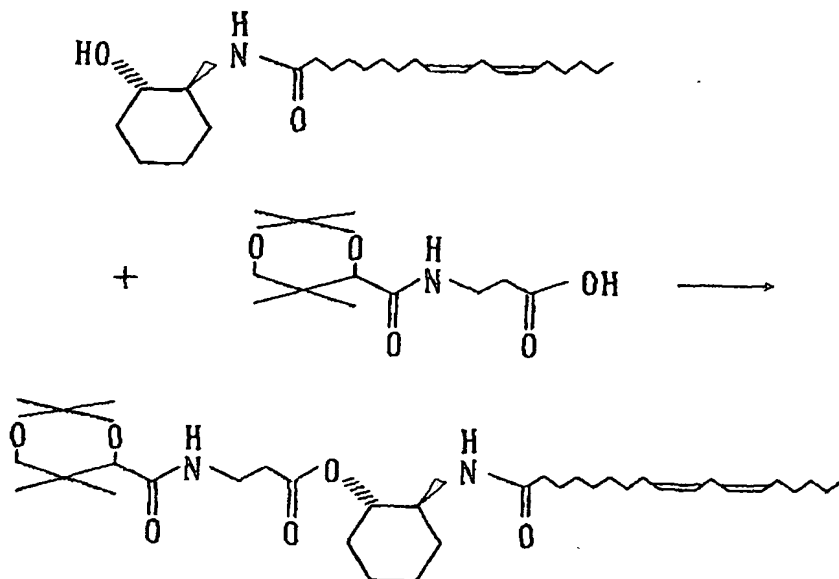
理論値 622.4920

\* 実測値 622.4930

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.88 (3H, t, J=7Hz) ,  
0.99 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.11-1.34  
(32H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.48 (3H, s) ,  
1.50-1.83 (4H, m) , 1.92-2.18 (2H, m) ,  
2.10 (2H, t, J=7Hz) , 2.51 (2H, t, J=6Hz) ,  
3.29 (1H, d, J=12Hz) , 3.31-3.42 (1H, m) ,  
3.57-3.68 (1H, m) , 3.69 (1H, d, J=12Hz) ,  
3.83-3.95 (1H, m) , 4.08 (1H, s) , 4.64  
(1H, td, J=11Hz, 5Hz) , 5.74 (1H, d, J=8Hz) ,  
6.95 (1H, t, J=6Hz)

実施例-80

(1S,2S) - 2 - (リノレオイルアミノ) シクロヘキサノール 3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート



(1S,2S) - 2 - (N-リノレオイルアミノ) シクロヘキサノール3.77gと3 - [N - (2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオン酸2.59gとジシクロヘキシルカルボジイミド2.06g及び4 - (N,N-ジメチルアミノ) ピリジン1.22gとをトルエン30mlに溶かし、一夜加熱還流した。反応終了後冷却し沈澱物を除き、有機層を1規定塩酸、水次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させた。溶媒を留去し、残留物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物2.72g (収率44%) を得た。

性状；油状

旋光度  $[\alpha]_D$  ; +13.5° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

IR (cm<sup>-1</sup>, neat) ;  $\nu_{C=O}$  1736, 1654

質量分析 分子式；C<sub>36</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

理論値 618.4607

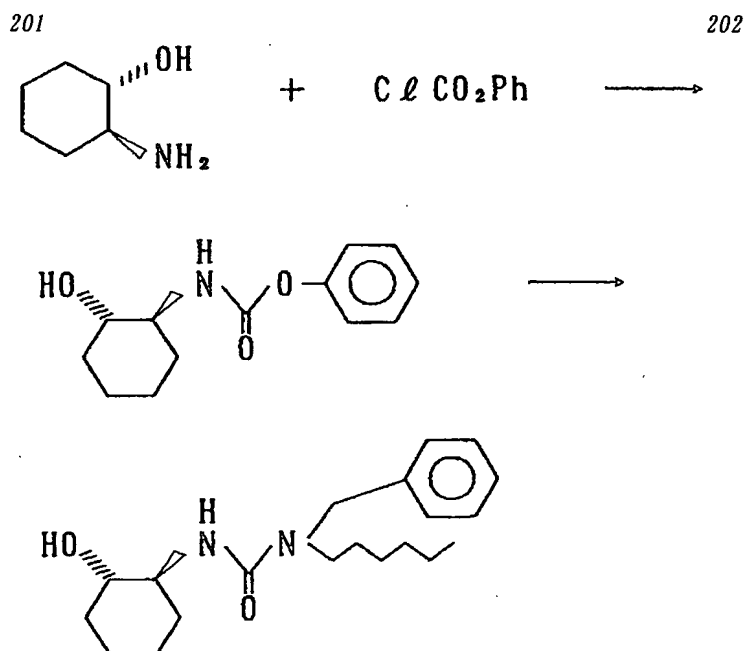
実測値 618.4612

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) ; 0.89 (3H, t, J=7Hz) ,  
0.96 (3H, s) , 1.04 (3H, s) , 1.11-1.39  
(18H, m) , 1.43 (3H, s) , 1.47 (3H, s) ,  
1.51-1.81 (4H, m) , 1.95-2.18 (6H, m) ,  
2.10 (2H, t, J=7Hz) , 2.50 (2H, t, J=6Hz) ,  
2.77 (1H, t, J=6Hz) , 3.28 (1H, d, J=12Hz) ,  
3.46-3.57 (2H, m) , 3.69 (1H, d, J=12Hz) ,  
3.32-3.43 (1H, m) , 4.09 (1H, s) , 4.64  
(1H, td, J=11Hz, 5Hz) , 5.28-5.43 (4H, m) ,  
5.80 (1H, d, J=8Hz) , 6.91 (1H, t, J=6Hz)

参考例22

(1S,2S) - 2 - (N-ベンジル-N-ヘキシルカルバモイル) アミノシクロヘキサノール

(101)



(1S, 2S) - 2 - アミノシクロヘキサノール 345mg 及び炭酸ナトリウム 424mg を酢酸エチル 10ml 及び水 10ml に溶かし氷冷攪拌下にクロル炭酸フェニル 470mg を酢酸エチル 5ml に溶かした溶液を滴下し、滴下終了後 2 時間攪拌した。反応終了後、水層を分取し酢酸エチルにより抽出後、有機層を合せ、飽和食塩水で洗浄した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後溶媒を留去し、得られた残留物に、N - ベンジルヘキシルアミン 1.15g を加え、100℃ で 1 時間攪拌した。反応終了後、残留物をシリカゲルクロマトグ\*

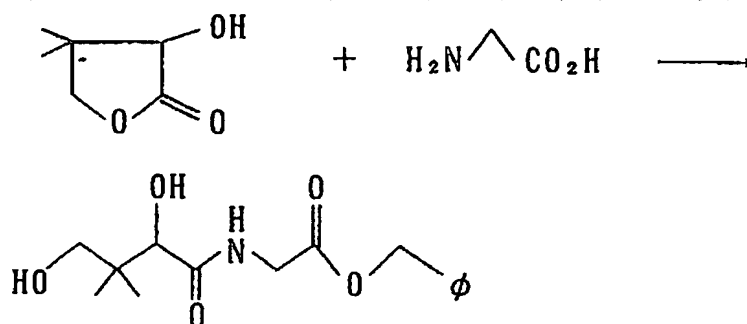
\* ラフィーに供し精製し標記化合物 866mg (収率 87%) を得た。

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ )

0.87 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.96-2.08 (16H, m), 3.15 - 3.54 (4H, m), 4.25 (1H, d,  $J=6\text{Hz}$ ), 4.47 (2H, s), 4.67 (1H, d,  $J=3\text{Hz}$ ), 7.20-7.41 (5H, m)

参考例 23

ベンジル 2 - [N - (2, 4 - ジヒドロキシ - 3, 3 - ジメチルブタノイル) アミノ] アセテート



パントイルラクトン 13.0g とグリシン 8.3g 及び 85% 水酸化カリウムとをメタノール 100ml に溶かし、3 時間加熱還流した。反応液を減圧下、溶媒を留去した。残留物を乾燥後、ジメチルホルムアミド 150ml に溶かし、ベンジルプロマイド 18.8g を加え室温で 20 時間攪拌した。反応液を減圧下留去し、残留物を水に溶かし酢酸エチルで抽出した。有機層を水、次いで飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに供し精製し、標記化合物 12.8g (43%) を得た。

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ )

0.95 (3H, s), 1.06 (3H, s), 2.73 (2H, br-s), 3.51 (1H, d,  $J=11\text{Hz}$ ), 3.56 (1H, d,  $J=11\text{Hz}$ ), 4.03-4.21 (2H, m), 4.09 (1H, s), 5.19 (2H, s), 7.23-7.28 (1H, m), 7.33-7.42 (5H, m)

実施例 81 ~ 164

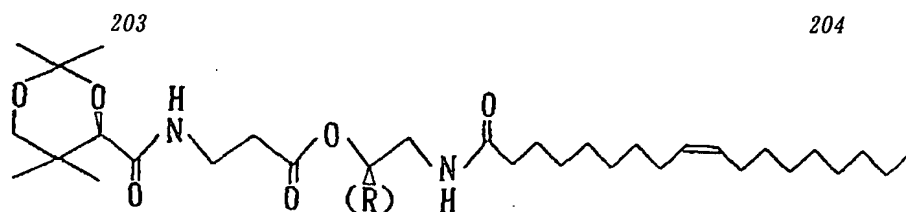
実施例 1 と同様にして以下の化合物を製造した。

実施例 81

化合物名: (R) - 1 - メチル - 2 - オレオイルアミノエチル 3 - [N - 2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート  
構造式:



(102)

分子式:  $C_{33}H_{60}N_2O_6$ 

分子量: 580.85

質量分析 計算値: 580.4451

実測値: 580.4448

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{22}_D$ ; +31.1° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3332, 2932, 2860, 1740, 1660

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.99 (3H, s), 1.02 (3H, s),

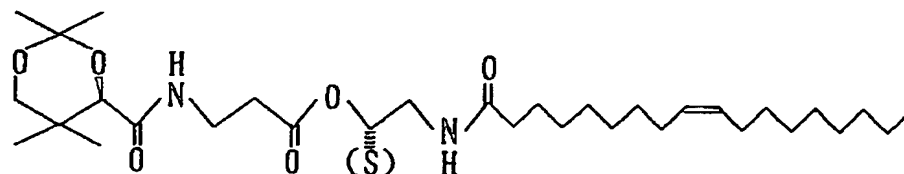
1.21-1.38 (23H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),

\* 1.55-1.69 (2H, m), 1.91-2.08 (4H, m), 2.20 (2H, t, J=7Hz), 2.44-2.62 (2H, m), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.30-3.53 (3H, m), 3.65-3.78 (1H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.07 (3H, s), 4.92-5.03 (1H, m), 5.29-5.40 (2H, m), 6.30-6.38 (1H, m), 6.91 (1H, t, J=6Hz)

実施例82

化合物名: (S)-1-メチル-2-オレオイルアミノエチル 3-[N-2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式:  $C_{33}H_{60}N_2O_6$ 

分子量: 580.85

質量分析 計算値: 580.4451

実測値: 580.4458

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{23}_D$ ; +21.6° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3332, 2932, 2860, 1738, 1662

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s),

1.20-1.37 (23H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),

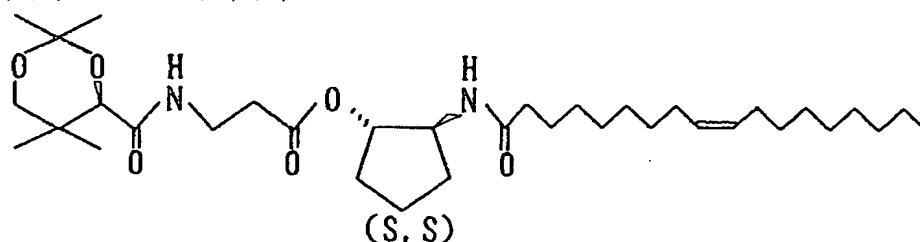
1.56-1.68 (2H, m), 1.91-2.08 (4H, m), 2.20

※ (2H, t, J=7Hz), 2.44-2.62 (2H, m), 3.26-3.35 (1H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.42-3.58 (2H, m), 3.64-3.75 (1H, m), 3.70 (1H, d, J=12Hz), 4.07 (1H, s), 4.93-5.03 (1H, m), 5.28-5.41 (2H, m), 6.27-6.34 (1H, m), 6.88-6.96 (1H, m)

実施例83

化合物名: (1S,2S)-2-(オレオイルアミノ)シクロペンタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

分子式:  $C_{35}H_{62}N_2O_6$ 

分子量: 606.89

質量分析 計算値: 606.4607

実測値: 606.4617

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{23}_D$ ; +24.5° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3324, 2932, 2860, 1736, 1654

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

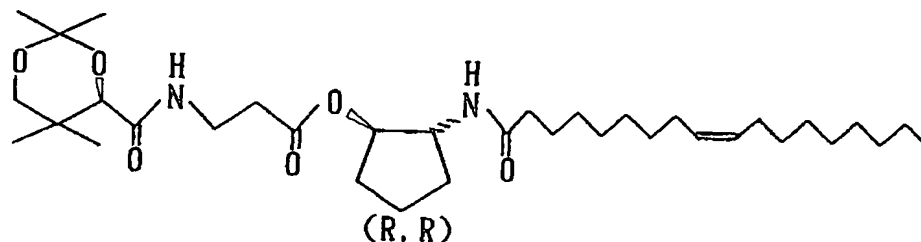
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.20-1.48 (22H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.52-2.09 (9H, m), 2.13 (2H, t, J=7Hz), 2.18-2.22 (1H, m), 2.54 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.48-3.59 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.08-4.19 (1H, m), 4.92-5.01 (1H, m), 5.29-5.40 (2H, m), 5.72 (1H, d, J=7Hz), 6.98 (1H, t, J=6Hz)

50 実施例84

(103)

205

化合物名：(1R, 2R) - 2 - (オレオイルアミノ) シクロペンタン-1-イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] \*

分子式：C<sub>35</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量：606.89

質量分析 計算値：606.4607

実測値：606.4614

融点 (°C) : oil

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>24</sup>; +14.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>) :

3328, 2932, 2860, 1740, 1656

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.99 (3H, s), 1.04 (3H, s),

1.21-1.47 (22H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s),

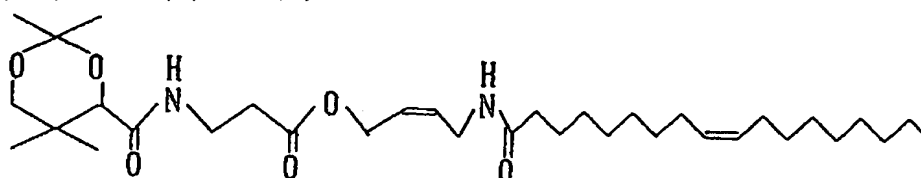
1.53-2.12 (9H, m), 2.13 (2H, t, J=7Hz), 2.18-

※ 2.31 (1H, m), 2.54 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.36-3.49 (1H, m), 3.58-3.69 (1H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.09-4.20 (1H, m), 4.95-5.02 (1H, m), 5.29-5.40 (2H, m), 5.72 (1H, d, J=7Hz), 7.02 (1H, t, J=6Hz)

実施例85

化合物名：4-オレオイルアミノ-(Z)-2-ブテニル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式：

分子式：C<sub>34</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量：592.80

質量分析 計算値：592.4451

実測値：592.4424

融点 (°C) : oil

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>24</sup>; +22.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>) :

3336, 2932, 2860, 1740, 1660

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.90 (3H, s), 1.04 (3H, s),

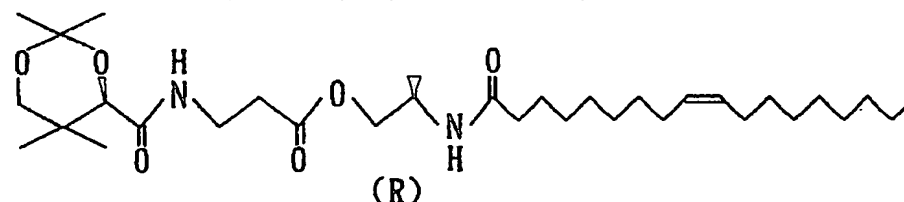
1.20-1.38 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s),

☆ 1.54-1.69 (2H, m), 1.91-2.08 (4H, m), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.57 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.42-3.67 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.97 (2H, dd, J=6Hz, 6Hz), 4.08 (1H, s), 4.70 (2H, d, J=6Hz), 5.29-5.40 (2H, m), 5.59-5.80 (3H, m), 6.88-6.96 (1H, m)

実施例86

化合物名：(2R) - 2 - メチル-2-オレオイルアミノ エチル 3-[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式：

分子式：C<sub>33</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量：580.85

質量分析 計算値：580.4451

実測値：580.4458

融点 (°C) : oil

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>25</sup>; +31.0° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>) :

3324, 2932, 2860, 1740, 1660

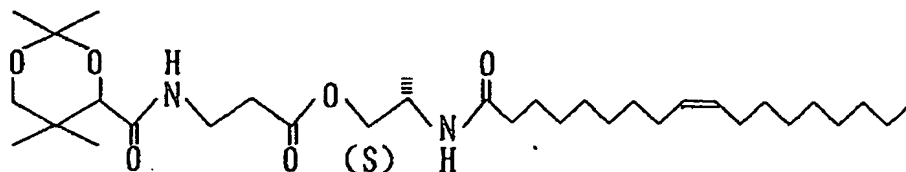
NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.98 (3H, s), 1.04 (3H, s),

(104)

207

1.18 (3H, d, J=6Hz), 1.23-1.39 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.57-1.68 (2H, m), 1.92-2.08 (4H, m), 2.16 (2H, t, J=7Hz), 2.58 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.57 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.03-4.14 (2H, m), 4.07 (1H, s), 4.26-4.37 (1H, m), 5.29-5.40 (2H, m)<sup>☆</sup>, 5.84 (1H, d, J=8Hz), \*

分子式: C<sub>33</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 580.85

質量分析 計算値: 580.4451

実測値: 580.4442

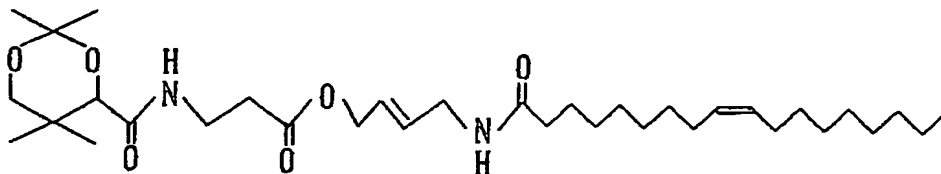
融点 (°C): oil

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>25</sup>; +13.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2860, 1744, 1654

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
1.16 (3H, d, J=6Hz), 1.21-1.39 (20H, m),  
1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.54-1.68 (2H, m),

分子式: C<sub>34</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 592.86

質量分析 計算値: 592.4451

実測値: 592.4459

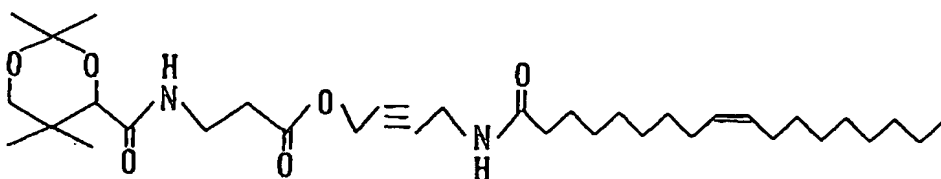
融点 (°C): oil

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>25</sup>; +22.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3328, 2932, 2860, 1740, 1660

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
1.21-1.38 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
1.56-1.69 (2H, m), 1.91-2.08 (4H, m), 2.18

分子式: C<sub>34</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 590.85

\* 6.98 (1H, t, J=6Hz)

実施例87

化合物名: (2S)-2-メチル-2-オレオイルアミノ  
エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジ  
オキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

※ 1.92-2.08 (4H, m), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.58 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.49-3.67 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.05 (1H, dd, J=11Hz, 4Hz), 4.07 (1H, s), 4.13 (1H, dd, J=11Hz, 5Hz), 4.22-4.36 (1H, m), 5.29-5.42 (2H, m), 5.92 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=5 Hz)

20 実施例88

化合物名: 4-オレオイルアミノ-(E)-2-ブテニル  
3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ  
ン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

※ 構造式:

☆ (2H, t, J=7Hz), 2.58 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (2H, d, J=12Hz), 3.41-3.68 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.90 (2H, dd, J=6Hz, 6Hz), 4.08 (1H, s), 4.57 (2H, d, J=6Hz), 5.28-5.41 (2H, m), 5.52-5.62 (1H, m), 5.65-5.83 (2H, m), 6.95 (1H, t, J=6Hz)

実施例89

化合物名: 4-オレオイルアミノ-2-ブチニル 3-  
[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサ  
ン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

☆

質量分析 計算値: 590.4294

実測値: 590.4279

(105)

209

融点 (°C) : oil

旋光度  $[\alpha]^{25D}$ ; +21.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu_{\text{neat}}$ , cm<sup>-1</sup>) :

3320, 2932, 2860, 1748, 1662

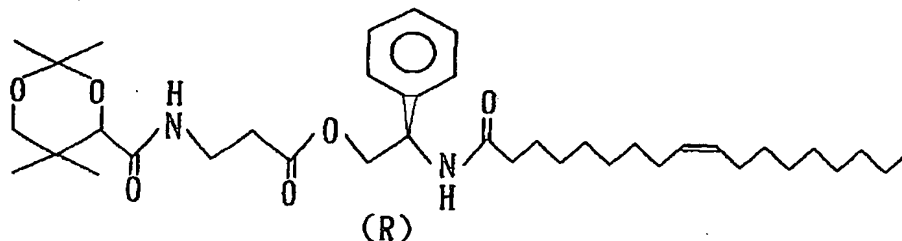
NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s),

1.21-1.39 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),

1.58-1.72 (2H, m), 1.92-2.08 (4H, m), 2.18

(2H, t, J=7Hz), 2.61 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (2H, \*

分子式 : C<sub>38</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量 : 642.92

質量分析 計算値 : 642.4607

実測値 : 642.4613

融点 (°C) : oil

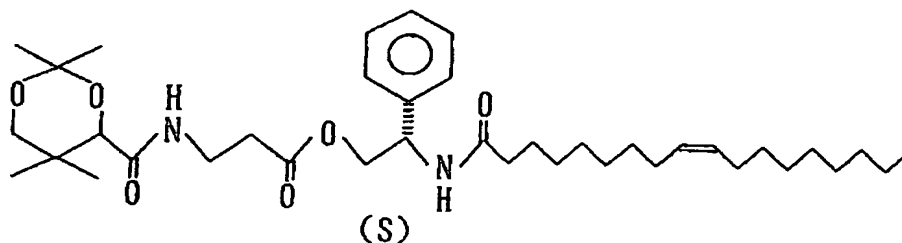
旋光度  $[\alpha]^{24D}$ ; -0.4° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu_{\text{neat}}$ , cm<sup>-1</sup>) :

3320, 2932, 2864, 1744, 1654

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.90 (3H, s), 1.04 (3H, s),

1.21-1.38 (20H, m), 1.44 (3H, s), 1.47 (3H, s), ※

分子式 : C<sub>38</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量 : 642.92

質量分析 計算値 : 642.4607

実測値 : 642.4613

融点 (°C) : oil

旋光度  $[\alpha]^{26D}$ ; +40.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu_{\text{neat}}$ , cm<sup>-1</sup>) :

3320, 2932, 2860, 1742, 1660

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.90 (3H, s), 1.03 (3H, s),

1.21-1.39 (20H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s),

1.57-1.74 (2H, m), 1.92-2.08 (4H, m), 2.25

210

\* d, J=12Hz), 3.42-3.68 (2H, m), 3.70 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.08-4.11 (2H, m), 4.69-4.72 (2H, m), 5.29-5.42 (2H, m), 5.68-5.78 (1H, m), 6.96 (1H, t, J=5Hz)

実施例90

化合物名 : (2R) - 2-オレオイルアミノ-2-フェニルエチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式 :

※ 1.57-1.70 (2H, m), 1.92-2.08 (4H, m), 2.25 (2H, t, J=7Hz), 2.52 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (2H, d, J=12Hz), 3.46-3.65 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.29-4.39 (2H, m), 5.29-5.42 (3H, m), 6.60 (1H, d, J=8Hz), 6.93 (1H, t, J=5Hz), 7.26-7.38 (5H, m)

実施例91

化合物名 : (2S) - 2-オレオイルアミノ-2-フェニルエチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式 :

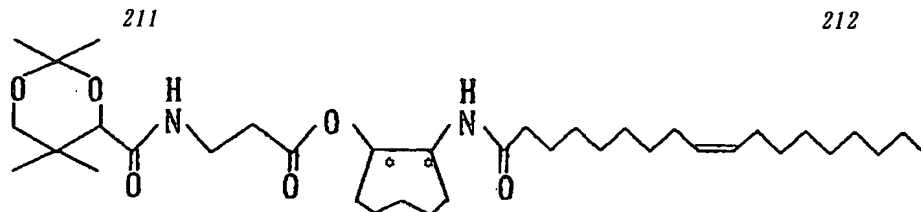
40 (2H, t, J=7Hz), 2.51 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (2H, d, J=12Hz), 3.42-3.67 (2H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.05 (1H, s), 4.31 (1H, dd, J=12Hz, 5Hz), 4.39 (1H, dd, J=12Hz, 6Hz), 5.28-5.41 (3H, m), 6.59 (1H, d, J=8Hz), 6.91 (1H, t, J=5Hz), 7.25-7.38 (5H, m)

実施例92

化合物名 : (trans) - 2-(オレオイルアミノ)シクロヘプタン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式 :

(106)



## (-)-trans-2-aminocycloheptanolより

分子式:  $C_{37}H_{66}N_2O_6$ 

分子量: 634.94

質量分析 計算値: 634.4920

実測値: 634.4911

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{26}_D$ ; +22.0° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3328, 2932, 2864, 1734, 1660

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.00 (3H, s), 1.04 (3H, s),

1.21-1.38 (20H, m), 1.41-2.08 (16H, m), 1.43

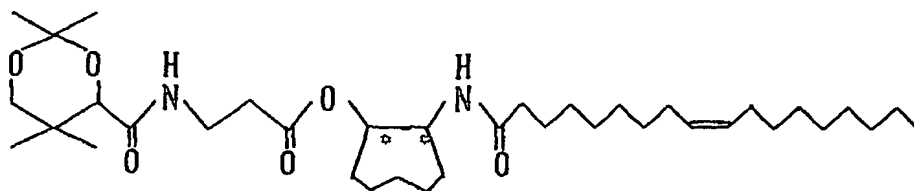
(3H, s), 1.47 (3H, s), 2.09 (2H, t, J=7Hz), \*

\* 2.50 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.32  
- 3.44 (1H, m), 3.57-3.68 (1H, m), 3.69 (1H,  
10 d, J=12Hz), 3.99-4.09 (1H, m), 4.08 (1H, s),  
4.77-4.84 (1H, m), 5.29-5.40 (2H, m), 5.82  
(1H, d, J=8Hz), 6.97 (1H, t, J=6Hz)

実施例93

化合物名: (trans) - 2 - (オレオイルアミノ) シク  
ロヘプタン-1-イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラ  
メチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ]  
プロピオネート

構造式:



## (+) - trans-2-aminocycloheptanolより

分子式:  $C_{37}H_{66}N_2O_6$ 

分子量: 634.94

質量分析 計算値: 634.4920

実測値: 634.4904

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{26}_D$ ; +13.1° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3324, 2932, 2864, 1734, 1650

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),

1.21-1.38 (20H, m), 1.40-2.08 (16H, m), 1.43

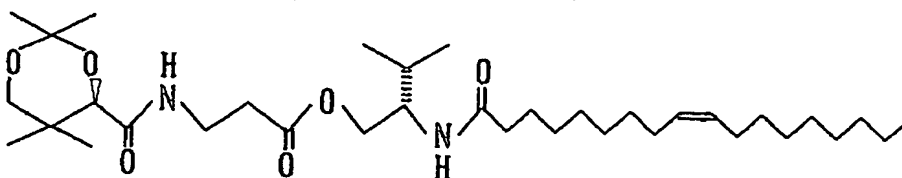
※

※ (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.10 (2H, t, J=7Hz),  
2.50 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.51  
(2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.69 (1H, d, J=12Hz),  
30 3.97-4.08 (1H, m), 4.09 (1H, s), 4.77-4.84  
(1H, m), 5.29-5.42 (2H, m), 5.89 (1H, d, J=8Hz),  
6.92 (1H, t, J=6Hz)

実施例94

化合物名: (2S) - 3 - メチル-2-オレオイルアミノ  
ブチル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジ  
オキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式:  $C_{35}H_{64}N_2O_6$ 

分子量: 608.91

質量分析 計算値: 608.4764

実測値: 608.4741

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{24}_D$ ; +4.9° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3324, 2932, 2860, 1742, 1652

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

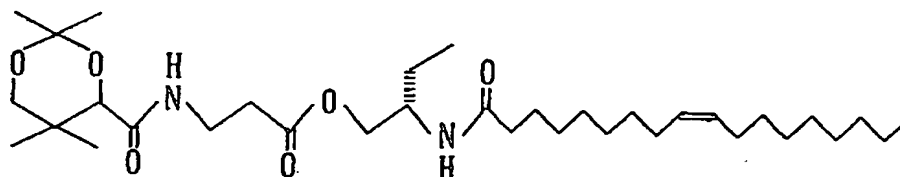
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.93 (3H, d, J=6Hz), 0.95  
(3H, d, J=6Hz), 0.97 (3H, s), 1.07 (3H, s),  
1.21-1.39 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
1.56-1.86 (3H, s), 1.90-2.08 (4H, m), 2.20  
50 (2H, t, J=7Hz), 2.56 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H,

(107)

213

d, J=12Hz), 3.56 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 3.95-4.29 (3H, m), 4.07 (1H, s), 5.29-5.41 (2H, m), 5.79 (1H, d, J=8Hz), 6.93 (1H, t, J=6Hz)

実施例95

分子式: C<sub>34</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 594.88

質量分析 計算値: 594.4607

実測値: 594.4597

融点 (°C): oil

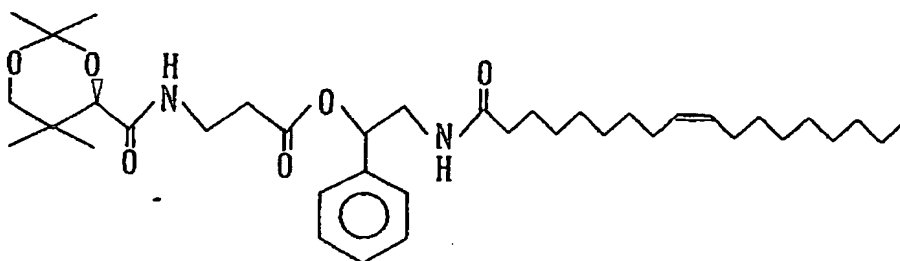
旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>25</sup>; +6.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2864, 1742, 1652

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.91 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.21-1.38 (20H, m), 1.42 (3H, s), 1.44-1.68 (4H, m), 1.47 (3H, s),

※



※ 1.91-2.08 (4H, m), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.58 (2H, t, J=6Hz), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.57 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.03-4.24 (3H, m), 4.07 (1H, s), 5.29-5.42 (2H, m), 5.84 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=6Hz)

実施例96

化合物名: 2-オレオイルアミノ-1-フェニルエチル

20 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

diastereomer mix

分子式: C<sub>38</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 642.92

質量分析 計算値: 642.4607

実測値: 642.4606

融点 (°C): oil

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>24</sup>; +24.3° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3324, 2932, 2864, 1744, 1660

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.91 (3/2H, s), 0.99 (3/2H, s), 1.03 (3/2H, s), 1.04 (3/2H, s), 1.19-1.38 (20H, m), 1.41 (3/2H, s), 1.42 (3/2H, s), 1.43 (3H, s), 1.52-1.66 (2H, m),

1.92-2.08 (4H, m), 2.12-2.22 (2H, m), 2.48-2.67 (2H, m), 3.26 (1/2H, d, J=12Hz), 3.29 (1/2H, d, J=12Hz), 3.42-3.85 (4H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.06 (1/2H, s), 4.07 (1/2H, s), 5.29-5.41 (2H, m), 5.84 (1/2H, d, J=8Hz), 5.86 (1/2H, d, J=8Hz), 6.16-6.27 (1H, m), 6.88-6.97 (1H, m), 7.27-7.38 (5H, m)

40 実施例97

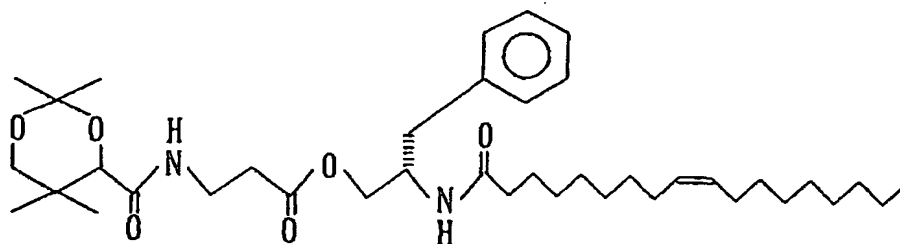
化合物名: (2S)-2-オレオイルアミノ-3-フェニルプロピル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式:

(108)

215

216

分子式:  $C_{39}H_{64}N_2O_6$ 

分子量: 656.95

質量分析 計算値: 656.4764

実測値: 656.4740

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{25}_D$ ; +18.3° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3316, 2932, 2860, 1742, 1660

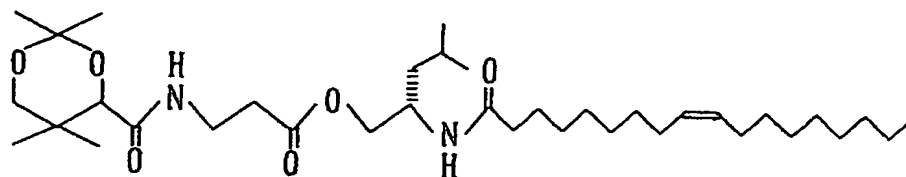
NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
 1.17-1.38 (20H, m), 1.41 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
 1.50-1.68 (2H, m), 1.92-2.08 (4H, m), 2.16

\* (2H, t, J=7Hz), 2.59 (2H, t, J=6Hz), 2.78 (1H, dd, J=13Hz, 6Hz), 2.89 (1H, dd, J=13Hz, 7Hz),  
 10 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.39-3.69 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 4.04-4.09 (2H, m), 4.08 (1H, s), 4.37-4.47 (1H, m), 5.28-5.41 (2H, m), 6.07 (1H, d, J=8Hz), 6.93 (1H, t, J=5Hz), 7.16-7.32 (5H, m)

実施例98

化合物名: (2S)-4-メチル-2-オレオイルアミノペンチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
 構造式:

分子式:  $C_{36}H_{66}N_2O_6$ 

分子量: 622.93

質量分析 計算値: 622.4920

実測値: 622.4895

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{25}_D$ ; +7.6° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3320, 2932, 2864, 1742, 1652

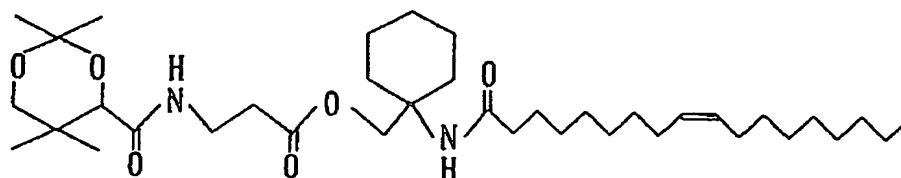
NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.91 (3H, t, J=6Hz), 0.93 (3H, t, J=6Hz), 0.97 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
 1.19-1.41 (20H, m), 1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s),

※ 1.53-1.77 (5H, m), 1.90-2.08 (4H, m), 2.17 (2H, t, J=7Hz), 2.57 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.56 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.07 (1H, s), 4.07 (1H, dd, J=11Hz, 4Hz), 4.13 (1H, dd, J=11Hz, 4Hz), 4.21-4.35 (1H, m), 5.28-5.41 (2H, m), 5.72 (1H, d, J=8Hz), 6.94 (1H, t, J=6Hz)

実施例99

化合物名: 2-オレオイルアミノ-2,2-ペンタメチレンエチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
 構造式:

分子式:  $C_{37}H_{66}N_2O_6$ 

分子量: 634.94

質量分析 計算値: 634.4920

実測値: 634.4899

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{29}_D$ ; +22.0° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3352, 2936, 2864, 1742, 1664

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.21-1.67 (32H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
 1.91-2.13 (4H, m), 2.15 (2H, t, J=7Hz), 2.56 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.46-3.63 (2H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 4.07 (1H,

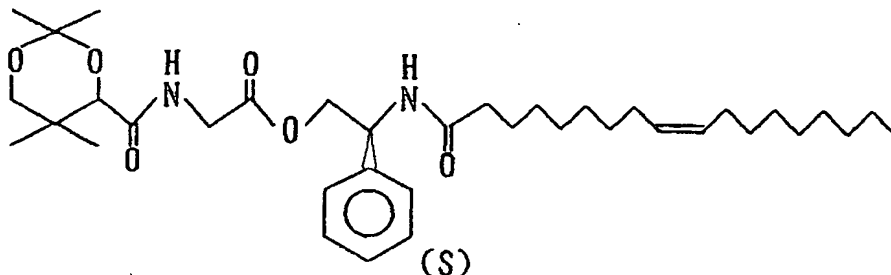
50

(109)

217

s), 4.31 (1H, d, J=11Hz), 4.36 (1H, d, J=11Hz),  
5.13 (1H, s), 5.28-5.42 (2H, m), 6.96 (1H, t,  
J=5Hz)

実施例100

分子式: C<sub>37</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 628.90

質量分析 計算値: 628.4451

実測値: 628.4440

融点 (°C): oil

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>20</sup>; +46.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2864, 1760, 1662

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 1.04 (6H, s), 1.19-1.38  
(20H, m), 1.43 (3H, s), 1.48 (3H, s), 1.51-

218

\* 化合物名: (2S)-2-オレオイルアミノ-2-フェニル  
エチル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-  
ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]アセテート

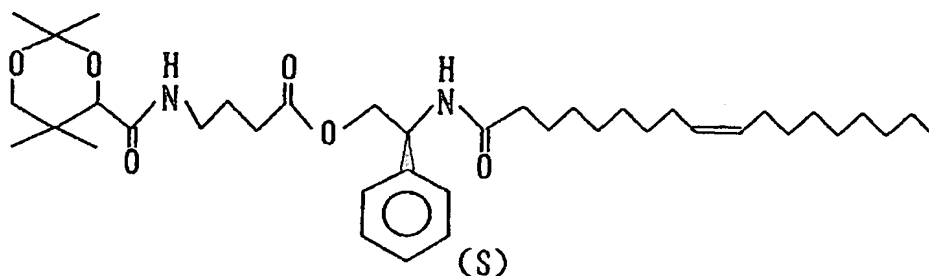
\* 構造式:

※ 1.69 (2H, m), 1.91-2.05 (4H, m), 2.24 (2H, t,  
J=7Hz), 3.30 (1H, d, J=12Hz), 3.69 (1H, d,  
J=12Hz), 3.98 (2H, d, J=5Hz), 4.09 (1H, s),  
4.39 (1H, dd, J=11Hz, 6Hz), 4.56 (1H, dd, J=11Hz,  
5Hz), 5.28-5.40 (3H, m), 6.25 (1H, d, J=8Hz),  
7.00 (1H, t, J=5Hz), 7.26-7.39 (5H, m)

実施例101

20 化合物名: (2S)-2-オレオイルアミノ-2-フェニル  
エチル 4-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-  
ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]ブタノエート

\* 構造式:

分子式: C<sub>39</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 656.95

質量分析 計算値: 656.4764

実測値: 656.4770

融点 (°C): oil

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>30</sup>; +41.4° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2864, 1744, 1654

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

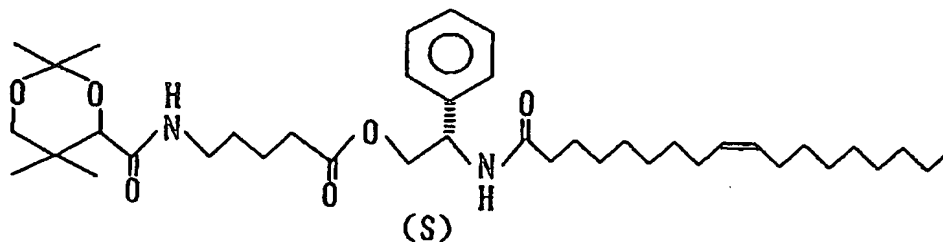
0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.99 (3H, s), 1.06 (3H, s),  
1.21-1.38 (20H, m), 1.44 (3H, s), 1.48 (3H, s),

☆ 1.56-2.07 (8H, m), 2.26 (2H, t, J=7Hz), 2.32  
(2H, t, J=6Hz), 3.16-3.38 (2H, m), 3.30 (1H, d,  
J=12Hz), 3.70 (1H, d, J=12Hz), 4.09 (1H, s),  
4.38 (1H, dd, J=11Hz, 6Hz), 4.44 (1H, dd, J=11Hz,  
5Hz), 5.28-5.42 (3H, m), 6.64 (1H, t, J=5Hz),  
6.76 (1H, d, J=8Hz), 7.26-7.38 (5H, m)

実施例102

40 化合物名: (2S)-2-オレオイルアミノ-2-フェニル  
エチル 5-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-  
ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]ペンタノエート

\* 構造式:

分子式: C<sub>40</sub>H<sub>66</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

50 分子量: 670.98



(110)

219

質量分析 計算値:670.4920

実測値:670.4912

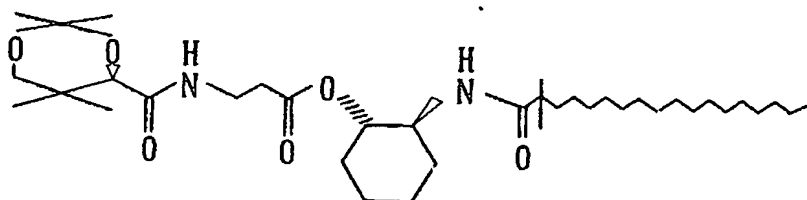
融点 (°C) :oil

旋光度  $[\alpha]^{30}_D$ ; +40.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu_{\text{neat}}$ , cm<sup>-1</sup>) :

3324, 2932, 2864, 1742, 1654

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.99 (3H, s), 1.05 (3H, s),  
 1.20-1.38 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 1.47-1.70 (6H, m), 1.92-2.08 (4H, m), 2.22  
 (2H, t, J=7Hz), 2.33 (2H, t, J=6Hz), 3.12-

分子式: C<sub>38</sub>H<sub>70</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量:650.99

質量分析 計算値:650.5233

実測値:650.5244

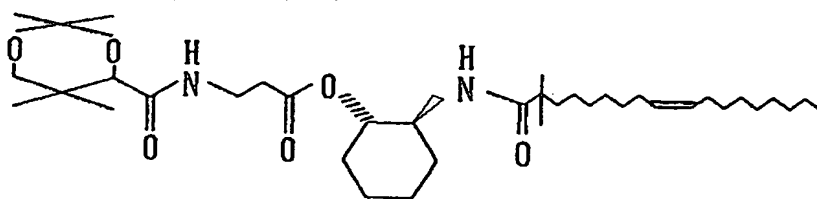
融点 (°C) :oil

旋光度  $[\alpha]^{28}_D$ ; +10.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu_{\text{neat}}$ , cm<sup>-1</sup>) :

3380, 2932, 2860, 1734

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.09 (6H, s), 1.10-2.16 (38H, m), 1.43 (3H, s), ※

分子式: C<sub>38</sub>H<sub>68</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量:648.97

質量分析 計算値:648.5077

実測値:648.5063

融点 (°C) :oil

旋光度  $[\alpha]^{28}_D$ ; +10.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu_{\text{neat}}$ , cm<sup>-1</sup>) :

3380, 2936, 2864, 1734, 1672

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.00-2.18  
 (34H, m), 1.03 (3H, s), 1.08 (6H, s), 1.42  
 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.41-2.62 (2H, m),

220

\* 3.30 (2H, m), 3.29 (1H, d, J=12Hz), 3.69 (1H,  
 d, J=12Hz), 4.08 (1H, s), 4.28 (1H, dd, J=11Hz,  
 5Hz), 4.43 (1H, dd, J=11Hz, 6Hz), 5.28-5.40  
 (3H, m), 6.19 (1H, d, J=8Hz), 6.68 (1H, t, J=  
 5Hz), 7.26-7.39 (5H, m)

実施例103

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2, 2 - ジメチルステアロイル)  
 アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2,  
 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニ  
 10 ル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

※ 1.47 (3H, s), 2.42-2.62 (2H, m), 3.28 (1H, d,  
 J=12Hz), 3.39-3.63 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12  
 20 Hz), 3.81-3.93 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.73  
 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.80 (1H, d, J=8  
 Hz), 6.92 (1H, t, J=5Hz)

実施例104

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2, 2 - ジメチルオレオイル)  
 アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2,  
 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニ  
 ル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

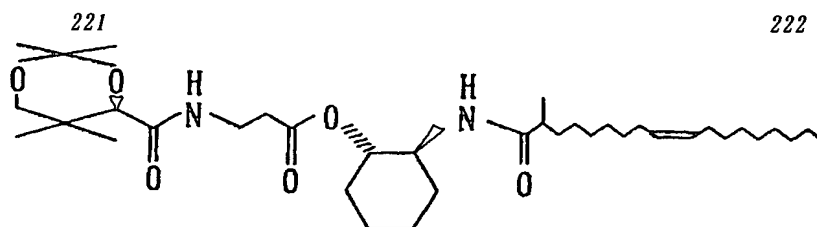
3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.38-3.62 (2H, m), 3.69  
 (1H, d, J=12Hz), 3.80-3.92 (1H, m), 4.07 (1H,  
 s), 4.73 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.28-  
 5.41 (2H, m), 5.79 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t,  
 J=5Hz)

40 実施例105

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2 - メチルオレオイル)  
 アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N - (2, 2, 5,  
 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボニル)  
 アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

(111)

分子式:  $C_{37}H_{66}N_2O_6$ 

分子量: 634.94

質量分析 計算値: 634.4920

実測値: 634.4950

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{28D}$ ; +10.8° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3324, 2936, 2864, 1734

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s),

1.06 (3/2H, d, J=7Hz), 1.08 (3/2H, d, J=7Hz),

1.09-2.18 (35H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), \*

\* 2.50 (2H, t, J=6Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz),

3.51 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.69 (1H, d, J=12Hz),

3.81-3.94 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.61-4.73

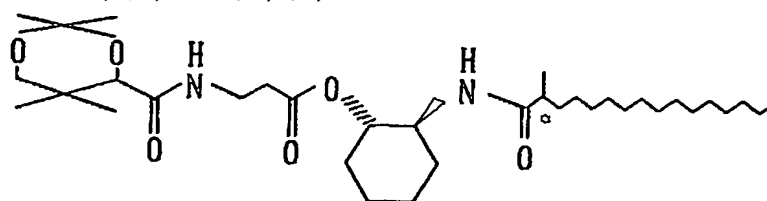
10 (1H, m), 5.28-5.42 (2H, m), 5.70-5.78 (1H, m),

6.91 (1H, t, J=6Hz)

実施例106

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-メチルパルミトイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - [N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式:  $C_{35}H_{64}N_2O_6$ 

分子量: 608.91

質量分析 計算値: 608.4764

実測値: 608.4754

融点 (°C): 77~79°C (ベンゼン/ヘキサン)

旋光度  $[\alpha]^{28D}$ ; +14.4° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{KBr}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3312, 2932, 2860, 1742, 1652

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s),

1.39 (3H, d, J=7Hz), 1.10-2.18 (35H, m), 1.43 ※

※ (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.43-2.58 (2H, m),

3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.51 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz),

3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.81-3.93 (1H, m), 4.08

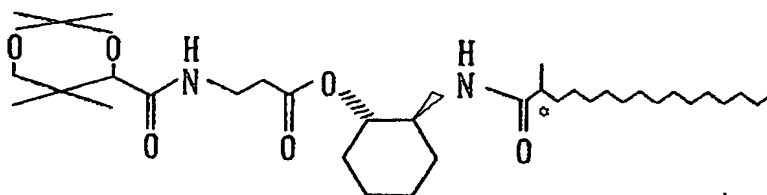
(1H, s), 4.68 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),

5.76 (1H, d, J=8Hz), 6.91 (1H, t, J=6Hz)

30 実施例107

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-メチルパルミトイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - [N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式:  $C_{35}H_{64}N_2O_6$ 

分子量: 608.91

質量分析 計算値: 608.4764

実測値: 608.4762

融点 (°C): 92~94°C (ベンゼン/ヘキサン)

旋光度  $[\alpha]^{19D}$ ; +6.7° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{KBr}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3284, 2928, 2860, 1736, 1652

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s),

1.06 (3H, d, J=7Hz), 1.10-2.17 (35H, m), 1.43

(3H, s), 1.47 (3H, s), 2.50 (2H, t, J=6Hz),

3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.51 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz),

3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.82-3.95 (1H, m), 4.08

(1H, s), 4.67 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),

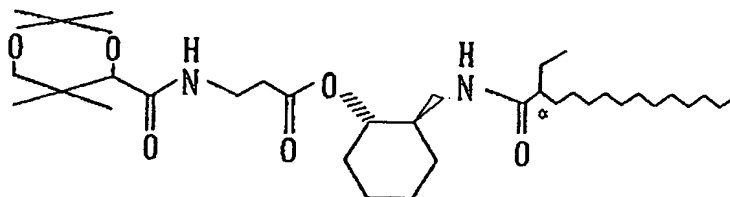
5.73 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=6Hz)

実施例108

50 化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-エチルミリストイ

(112)

223  
 ル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, 2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
 \* 構造式:



分子式:  $C_{34}H_{62}N_2O_6$   
 分子量: 594.88  
 質量分析 計算値: 594.4607  
 実測値: 594.4621

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{19D}$ ; +10.1° (C=1.0,  $CHCl_3$ )

IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3320, 2936, 2864, 1734, 1648

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

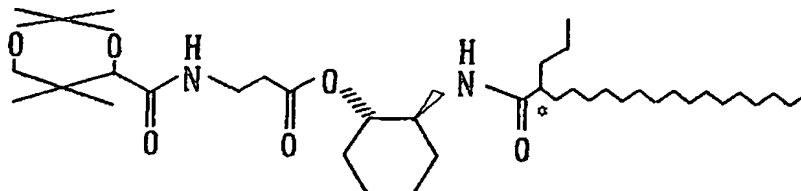
0.85 (3H, t, J=7Hz), 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.10-2.23 (33H, m),

※ 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.42-2.59 (2H, m),  
 10 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.51 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz),  
 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.82-3.95 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.68 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),  
 5.85 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=6Hz)

実施例109

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-プロピルステアロイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, 2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

※ 構造式:



分子式:  $C_{39}H_{72}N_2O_6$   
 分子量: 665.01  
 質量分析 計算値: 664.5390  
 実測値: 664.5395

融点 (°C): カラメル

旋光度  $[\alpha]^{19D}$ ; +9.6° (C=1.0,  $CHCl_3$ )

IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3288, 2932, 2860, 1730, 1670, 1644

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

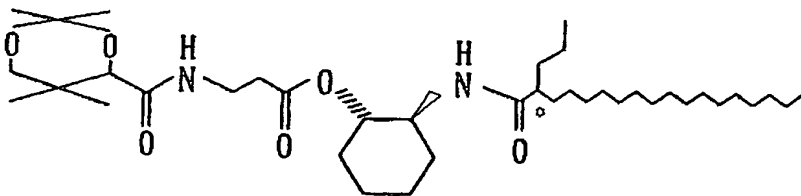
0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.12-2.23 (43H, m),

☆ 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.42-2.58 (2H, m),  
 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.51 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz),  
 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.83-3.95 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.68 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),  
 30 5.82 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=6Hz)

実施例111

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-プロピルステアロイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2, 2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

☆ 構造式:



分子式:  $C_{39}H_{72}N_2O_6$   
 分子量: 665.01  
 質量分析 計算値: 664.5390  
 実測値: 664.5390

融点 (°C): 103~105°C (ベンゼン/ヘキサン)

旋光度  $[\alpha]^{20D}$ ; +8.0° (C=1.0,  $CHCl_3$ )

IR ( $\nu_{KBr}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3288, 2928, 2860, 1730, 1666, 1644

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

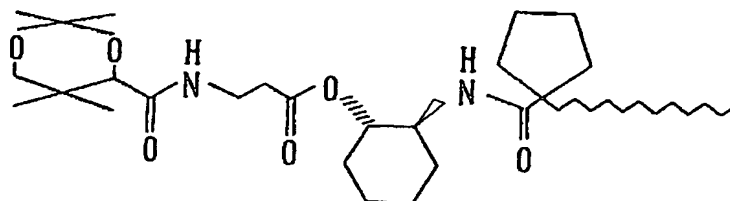
0.86 (3H, t, J=7Hz), 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.11-2.21 (43H, m),  
 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.41-2.60 (2H, m),  
 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.51 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz),  
 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.83-3.97 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.68 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),  
 50 5.77 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=6Hz)

(113)

225

## 実施例112

化合物名：(1S, 2S) - 2 - (1-ドデシルシクロペンタンカルボニル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 \*

分子式：C<sub>36</sub>H<sub>64</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量：620.92

質量分析 計算値：620.4764

実測値：620.4775

融点 (°C) : oil

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>22</sup> ; +9.2° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>) :

3360, 2932, 2864, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),

1.11-2.18 (38H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),

226

\* - [(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式：

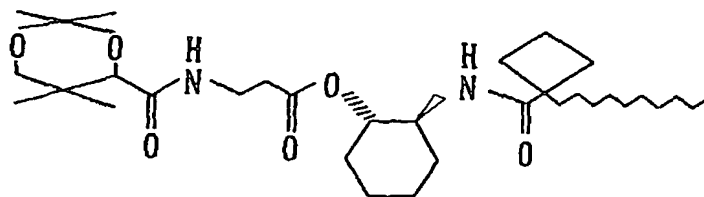
10※ 2.42-2.62 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.38-3.42 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.80-3.92 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.73 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.76 (1H, d, J=8Hz), 6.92 (1H, t, J=6Hz)

## 実施例113

化合物名：(1S, 2S) - 2 - (1-デシルシクロブタンカルボニル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 -

[(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式：

分子式：C<sub>33</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量：578.84

質量分析 計算値：578.4294

実測値：578.4285

融点 (°C) : oil

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>22</sup> ; +8.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>) :

3336, 2936, 2864, 1734

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),

1.06-1.40 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),

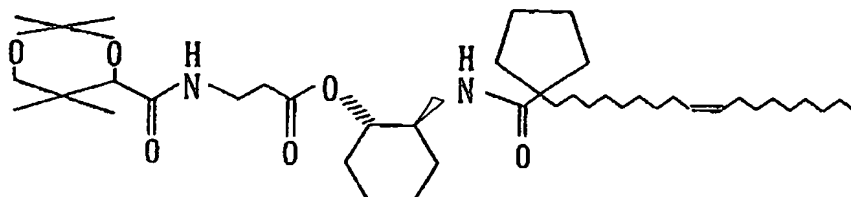
☆ 1.57-2.34 (12H, m), 2.43-2.62 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.41-3.62 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.81-3.94 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.71 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 5Hz), 5.59 (1H, d, J=8Hz), 7.92 (1H, t, J=5Hz)

## 実施例114

化合物名：(1S, 2S) - 2 - (1-9-オクタデセニルシクロペンタンカルボニル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 -

[N- (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式：

分子式：C<sub>42</sub>H<sub>74</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量：701.05

質量分析 計算値：702.5546

実測値：702.5570

融点 (°C) : oil

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>22</sup> ; +8.6° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>) :

3368, 2932, 2864, 1734

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.09-2.17 (46H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.41-2.61 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.37-3.62 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.81-

50 3.93 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.73 (1H, ddd,

(114)

227

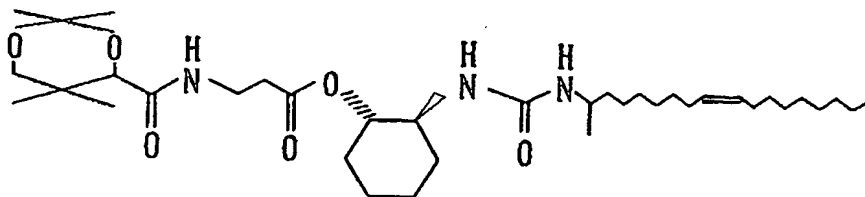
$J=11\text{Hz}, 11\text{Hz}, 4\text{Hz}$ ), 5.28-5.40 (2H, m), 5.75  
(1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.93 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ )

実施例115

化合物名: (1S, 2S) - 2 - [(1-メチル-8-ヘプ \*

228

\*タデセニル) カルバモイル] アミノシクロヘキサン-1  
-イル 3 - [N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジ  
オキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート  
構造式:



diastereomeric mixture

分子式:  $\text{C}_{37}\text{H}_{67}\text{N}_3\text{O}_6$ 

分子量: 649.96

質量分析 計算値: 649.5029

実測値: 649.5029

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{21\text{D}}; +19.3^\circ$  ( $C=1.0, \text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu_{\text{neat}}, \text{cm}^{-1}$ ):

3360, 2936, 2864, 1734, 1682, 1644

NMR ( $\delta, \text{CDCl}_3$ ):

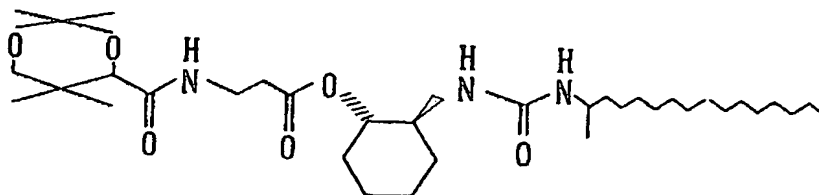
0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
1.08 (3/2H, d,  $J=6\text{Hz}$ ), 1.09 (3/2H, d,  $J=6\text{Hz}$ ),  
1.14-1.50 (24H, m), 1.44 (3H, s), 1.47 (3H, s), \*

※ 1.52-2.26 (1H, m), 2.37-2.59 (2H, m), 3.28  
- 3.46 (1H, m), 3.58-3.80 (3H, m), 3.69 (1H, d,  
 $J=12\text{Hz}$ ), 4.10 (1H, s), 4.55 (1H, ddd,  $J=11\text{Hz},$   
11Hz, 4Hz), 5.28-5.42 (2H, m), 6.86-6.96  
(1H, m)

実施例116

化合物名: (1S, 2S) - 2 - [(1-メチルヘプタデシ  
20 ル) カルバモイル] アミノシクロヘキサン-1-イル  
3 - [N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン  
-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式:  $\text{C}_{35}\text{H}_{65}\text{N}_3\text{O}_6$ 

分子量: 623.92

質量分析 計算値: 623.4873

実測値: 623.4852

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{21\text{D}}; +20.5^\circ$  ( $C=1.0, \text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu_{\text{KBr}}, \text{cm}^{-1}$ ):

3360, 2932, 2860, 1738, 1682, 1642

NMR ( $\delta, \text{CDCl}_3$ ):

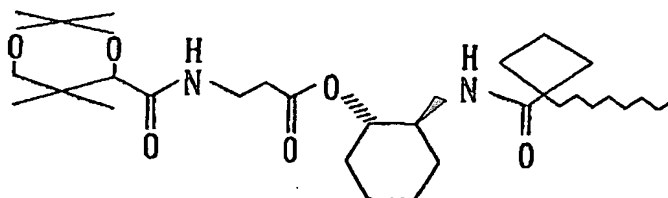
0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
1.08 (3H, d,  $J=6\text{Hz}$ ), 1.12-1.78 (32H, m), 1.44 \*

☆ (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.94-2.58 (4H, m),  
3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.34-3.79 (4H, m), 3.69  
(1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 4.10 (1H, s), 4.55 (1H, ddd,  
 $J=11\text{Hz}, 11\text{Hz}, 4\text{Hz}$ ), 6.92 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ )

実施例117

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (1-オクチルシクロブ  
タンカルボニル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 -  
[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4  
-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式:  $\text{C}_{31}\text{H}_{54}\text{N}_2\text{O}_6$ 

分子量: 550.78

質量分析 計算値: 550.3981

実測値: 550.4005

融点 (°C): oil

50 旋光度  $[\alpha]^{30\text{D}}; +13.1^\circ$  ( $C=1.0, \text{CHCl}_3$ )

(115)

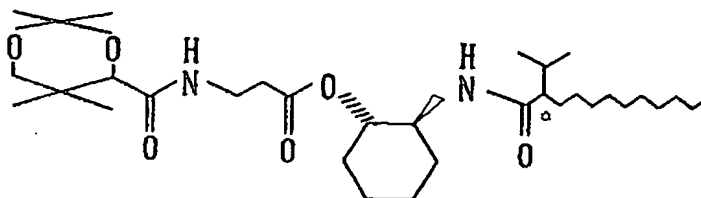
229

IR ( $\nu_{\text{neat}}$ ,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3336, 2932, 2860, 1732

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.06-1.58 (16H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 1.60-2.36 (12H, m), 2.43-2.63 (2H, m),  
 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.39-3.63 (2H, m), 3.69  
 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.81-3.94 (1H, m), 4.08 (1H,

分子式:  $\text{C}_{33}\text{H}_{60}\text{N}_2\text{O}_6$ 

分子量: 580.85

質量分析 計算値: 580.4451

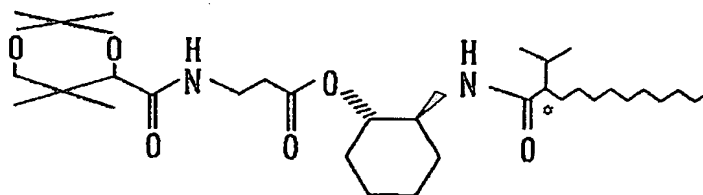
実測値: 580.4435

融点 ( $^{\circ}\text{C}$ ): wax旋光度 [ $\alpha$ ]  $^{27\text{D}}$ ; +11.9° ( $C=1.0$ ,  $\text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu_{\text{KBr}}$ ,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3288, 2932, 2860, 1730

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.88 (3H, d,  $J=6\text{Hz}$ ), 0.91  
 (3H, d,  $J=6\text{Hz}$ ), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.00-1.82 (26H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), ※

分子式:  $\text{C}_{33}\text{H}_{60}\text{N}_2\text{O}_6$ 

分子量: 580.85

質量分析 計算値: 580.4451

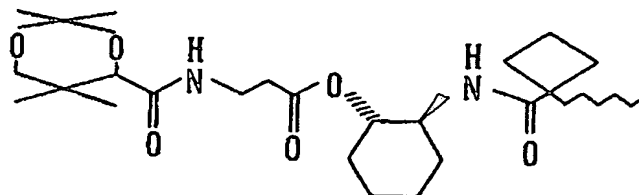
実測値: 580.4458

融点 ( $^{\circ}\text{C}$ ): カラメル旋光度 [ $\alpha$ ]  $^{30\text{D}}$ ; +10.6° ( $C=1.0$ ,  $\text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu_{\text{KBr}}$ ,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3276, 2932, 2860, 1730

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.85 (3H, d,  $J=6\text{Hz}$ ), 0.88 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.89  
 (3H, d,  $J=6\text{Hz}$ ), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.05-1.83 (26H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),



230

\* s), 4.72 (1H, ddd,  $J=11\text{Hz}, 11\text{Hz}, 4\text{Hz}$ ), 5.60  
 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.93 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ )

実施例118

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-イソプロピルラウロ  
 イル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3- [N-  
 (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カル  
 ボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

※ 1.93-2.04 (1H, m), 2.15-2.26 (1H, m), 2.41-  
 2.58 (2H, m), 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.42-3.60  
 (2H, m), 3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.82-3.94 (1H,  
 m), 4.08 (1H, s), 4.67 (1H, ddd,  $J=11\text{Hz}, 11\text{Hz},$   
 4Hz), 5.87 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.91 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ )

20 実施例119

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-イソプロピルラウロ  
 イル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3- [N-  
 (3, 3, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カル  
 ボニル) アミノ] プロピオネート

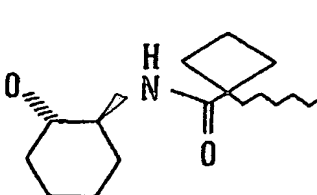
\* 構造式:

1.92-2.04 (1H, m), 2.13-2.22 (1H, m), 2.40-  
 2.58 (2H, m), 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.45-3.58  
 (2H, m), 3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.85-3.97 (1H,  
 m), 4.08 (1H, s), 4.68 (1H, ddd,  $J=11\text{Hz}, 11\text{Hz},$   
 4Hz), 5.78 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.90 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ )

実施例120

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (1-ヘキシルシクロブタ  
 ンカルボニル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-  
 [N- (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-  
 カルボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:



(116)

231

分子式:  $C_{29}H_{50}N_2O_6$ 

分子量: 522.73

質量分析 計算値: 522.3668

実測値: 522.3668

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{30D}$ ; +13.8° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3336, 2936, 2864, 1732

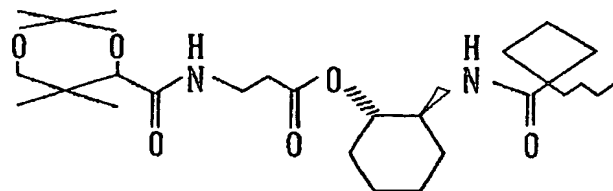
NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.87 (3H, t,  $J=7Hz$ ), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.07-1.58 (12H, m), 1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 1.61-2.34 (12H, m), 2.43-2.62 (2H, m), 3.28  
 (1H, d,  $J=12Hz$ ), 3.41-3.62 (2H, m), 3.69 (1H,  
 d,  $J=12Hz$ ), 3.82-3.93 (1H, m), 4.07 (1H, s),  
 4.71 (1H, ddd,  $J=11Hz, 11Hz, 4Hz$ ), 5.60 (1H, d,  
 $J=8Hz$ ), 6.92 (1H, t,  $J=5Hz$ )

実施例121

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (1-ブチルシクロブタン  
 カルボニル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-  
 [N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-  
 カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式:  $C_{30}H_{54}N_2O_6$ 

分子量: 538.77

質量分析 計算値: 538.3981

実測値: 538.3989

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{28D}$ ; +10.6° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

2932, 2860, 1732

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t,  $J=7Hz$ ), 0.97 (3H, s), 1.05 (3H, s),  
 1.06-1.44 (20H, m), 1.46-2.28 (12H, m), 2.44

232

分子式:  $C_{27}H_{46}N_2O_6$ 

分子量: 494.67

質量分析 計算値: 494.3355

実測値: 494.3366

融点 (°C): カラメル

旋光度  $[\alpha]^{30D}$ ; +15.2° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{KBr}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3348, 2940, 2868, 1732

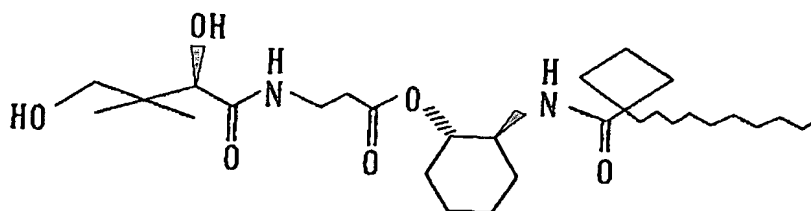
NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t,  $J=7Hz$ ), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.05-1.58 (8H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 1.62-2.33 (12H, m), 2.44-2.61 (2H, m), 3.28  
 (1H, d,  $J=12Hz$ ), 3.41-3.63 (2H, m), 3.69 (1H,  
 d,  $J=12Hz$ ), 3.81-3.94 (1H, m), 4.08 (1H, s),  
 4.72 (1H, ddd,  $J=11Hz, 11Hz, 4Hz$ ), 5.61 (1H, d,  
 $J=8Hz$ ), 6.93 (1H, t,  $J=5Hz$ )

実施例122

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (1-デシルシクロブタン  
 カルボニル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-  
 [N-(2, 4-ジヒドロキシ-3, 3-ジメチル-1-オキ  
 ソブチル) アミノ] プロピオネート

構造式:



- 2.64 (2H, m), 2.77 (2H, br-s), 3.46-3.68  
 (2H, m), 3.49 (1H, d,  $J=11Hz$ ), 3.56 (1H, d,  $J=$   
 11Hz), 3.84-3.98 (1H, m), 4.05 (1H, s),  
 4.69 (1H, ddd,  $J=11Hz, 11Hz, 4Hz$ ), 5.53 (1H, d,  
 $J=9Hz$ ), 7.37 (1H, t,  $J=5Hz$ )

40 実施例123

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (1-メチルラウロイル)  
 アミノシクロヘキサン-1-イル 3- [N-(2, 2, 5,  
 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル)  
 アミノ] プロピオネート

構造式:

50

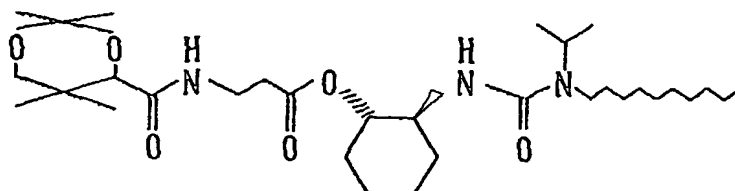


(118)

235

## 実施例126

化合物名：(1S,2S)-2-(N-デシル-N-イソプロピルカルバモイル)アミノシクロヘキサン-1-イル\*

分子式：C<sub>32</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

分子量：581.84

質量分析 計算値：581.4403

実測値：581.4414

融点(℃)：oil

旋光度〔α〕<sub>D</sub><sup>27</sup>；+30.1° (C=0.5, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>) :

2932, 2860, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s),

1.10 (6H, d, J=7Hz), 1.15-2.21 (24H, m), 1.42

(3H, s), 1.47 (3H, s), 2.47-2.62 (2H, m),

236

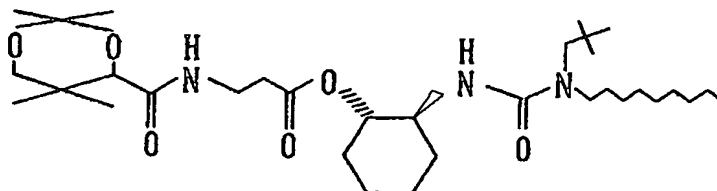
\* 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート  
構造式：

10※ 2.93 (2H, t, J=7Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz),  
3.34-3.64 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.74  
- 3.88 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.18-4.33 (1H, m),  
4.38-4.46 (1H, m), 4.71 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz,  
4Hz), 6.93 (1H, t, J=5Hz)

## 実施例127

化合物名：(1S,2S)-2-[N-(2,2-ジメチルプロピル)-N-ノニルカルバモイル]アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

※ 構造式：

分子式：C<sub>33</sub>H<sub>61</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

分子量：595.87

質量分析 m/e 595 (M<sup>+</sup>)

融点(℃)：69.4~72.9℃ (n-hexane)

IR (ν<sub>KBr</sub>, cm<sup>-1</sup>) :

3388, 2932, 1730, 1670, 1618, 1378, 1098

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>) :

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.91 (9H, s), 0.96 (9H, s),

1.04 (3H, s), 1.05-2.21 (22H, m), 1.42 (3H, s),

1.47 (3H, s), 2.43-2.62 (2H, m), 2.91 (1H, d,

J=15Hz), 2.97-3.10 (1H, m), 3.05 (1H, d, J=

15Hz), 3.16-3.27 (1H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz),

3.37-3.64 (2H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz),

☆ 3.71-3.86 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.52 (1H, d,  
J=8Hz), 4.70 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),  
30 6.92 (1H, t, J=5Hz)

## 元素分析

計算値：C, 66.52 H, 10.32 N, 7.05

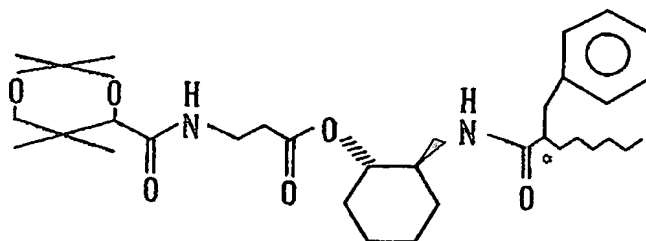
実測値：C, 66.26 H, 10.55 N, 7.30

## 実施例128

化合物名：(1S,2S)-2-(2-フェニルメチルカプリロイル)アミノシクロヘキサン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオネート

構造式：

☆ 40

分子式：C<sub>33</sub>H<sub>52</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量：572.79

質量分析 計算値：572.3825

実測値：572.3841

融点(℃)：カラムル

50 旋光度〔α〕<sub>D</sub><sup>21</sup>；-5.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)

(119)

237

IR ( $\nu_{\text{KBr}}$ ,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3304, 2936, 2864, 1734, 1662, 1646

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.87 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.95 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
 1.05-1.95 (18H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
 2.09-2.24 (1H, m), 2.37-2.54 (2H, m), 2.68  
 (2H, dd,  $J=13\text{Hz}$ , 5Hz), 2.83 (1H, dd,  $J=13\text{Hz}$ ,  
 10Hz), 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.48 (2H, dt,  
 $J=6\text{Hz}$ , 6Hz), 3.68 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.70-

分子式:  $\text{C}_{33}\text{H}_{52}\text{N}_2\text{O}_6$ 

分子量: 572.79

質量分析 計算値: 572.3825

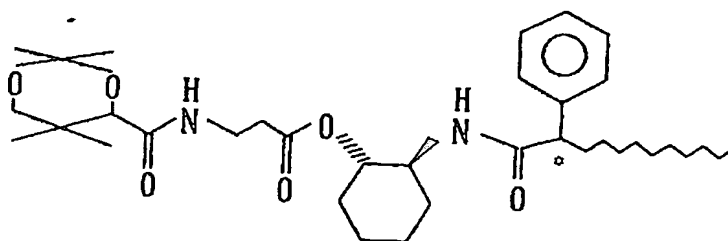
実測値: 572.3812

融点 ( $^{\circ}\text{C}$ ) : カラメル旋光度  $[\alpha]^{21\text{D}}$ ; +26.1 $^{\circ}$  ( $C=1.0$ ,  $\text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu_{\text{KBr}}$ ,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3320, 2940, 2864, 1734, 1652

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.87 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.95 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
 1.05-1.47 (12H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 1.51-2.31 (9H, m), 2.61 (1H, dd,  $J=14\text{Hz}$ , 5Hz), ※

分子式:  $\text{C}_{36}\text{H}_{58}\text{N}_2\text{O}_6$ 

分子量: 614.87

質量分析 計算値: 614.4294

実測値: 614.4310

融点 ( $^{\circ}\text{C}$ ) : oil旋光度  $[\alpha]^{30\text{D}}$ ; +14.8 $^{\circ}$  ( $C=0.9$ ,  $\text{CHCl}_3$ )IR ( $\nu_{\text{neat}}$ ,  $\text{cm}^{-1}$ ) :

3312, 2932, 2860, 1734

NMR ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ) :

0.87 (3H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.97 (3H, s), 1.05 (3H, s),  
 1.11-1.39 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.48 (3H, s),  
 1.52-2.11 (6H, m), 2.32-2.51 (2H, m), 3.25

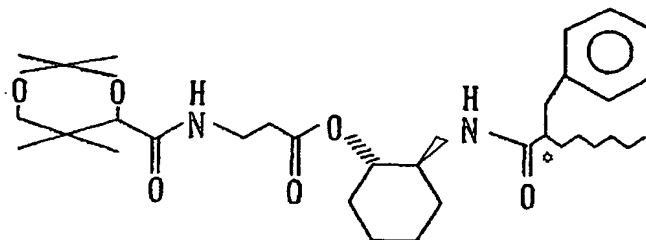
238

\* 3.82 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.50 (1H, ddd,  
 $J=11\text{Hz}$ , 11Hz, 4Hz), 5.42 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ),  
 6.88 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ ), 7.12-7.26 (5H, m)

実施例129

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-フェニルメチルカプ  
 リロイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3- [N-  
 (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カル  
 ボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

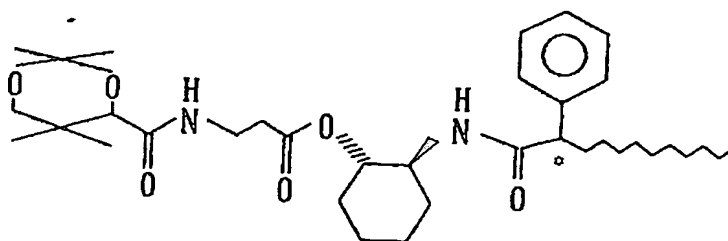


※ 2.94 (1H, dd,  $J=14\text{Hz}$ , 9Hz), 3.22-3.28 (2H, m),  
 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ),  
 3.70-3.84 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.55 (1H,  
 ddd,  $J=11\text{Hz}$ , 11Hz, 5Hz), 5.93 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ),  
 6.81 (1H, t,  $J=5\text{Hz}$ ), 7.12-7.30 (5H, m)

実施例130

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-フェニルラウロイ  
 ル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3- [N- (2,  
 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニ  
 ル) アミノ] プロピオネート

構造式:



(1H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 3.29 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.38-  
 3.56 (2H, m), 3.70 (1H, d, 12Hz), 3.77-3.89  
 (1H, m), 4.09 (1H, s), 4.59 (1H, ddd,  $J=11\text{Hz}$ ,  
 11Hz, 4Hz), 5.68 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.89 (1H, t,  
 $J=5\text{Hz}$ ), 7.21-7.36 (5H, m)

実施例131

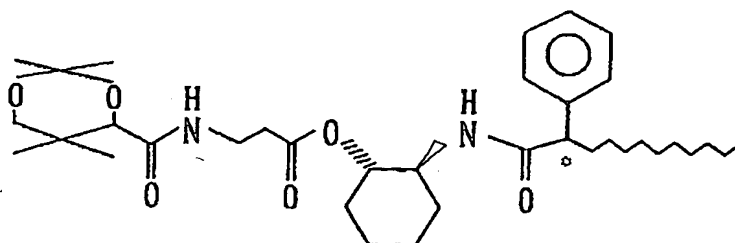
化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-フェニルラウロイ  
 ル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3- [N- (2,  
 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニ  
 ル) アミノ] プロピオネート

構造式:

(120)

239

240

分子式:  $C_{36}H_{58}N_2O_6$ 

分子量: 614.87

質量分析 計算値: 614.4294

実測値: 614.4311

融点 (°C): wax

旋光度  $[\alpha]_{D}^{30}$ ; +34.4° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{KBr}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3308, 2932, 2864, 1730

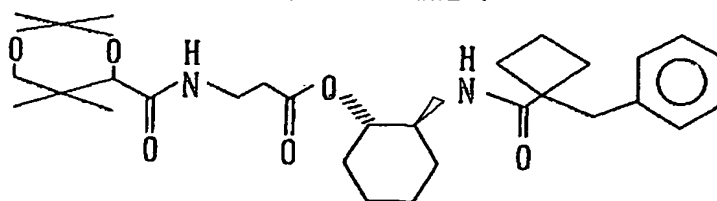
NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.94 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
1.09-1.42 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.48 (3H, s),

\* 1.52-2.15 (8H, m), 3.20-3.21 (3H, m), 3.28  
(1H, d, J=12Hz), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 3.76  
- 3.89 (1H, m), 4.06 (1H, s), 4.59 (1H, ddd,  
J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.75 (1H, d, J=8Hz), 6.71  
(1H, t, J=5Hz), 7.19-7.34 (5H, m)

実施例132

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (1-ベンジルシクロブタンカルボニル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-  
[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式:  $C_{30}H_{44}N_2O_6$ 

分子量: 528.69

質量分析 計算値: 528.3199

実測値: 528.3193

融点 (°C): カラメル

旋光度  $[\alpha]_{D}^{30}$ ; +11.9° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{KBr}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3356, 2944, 2868, 1732

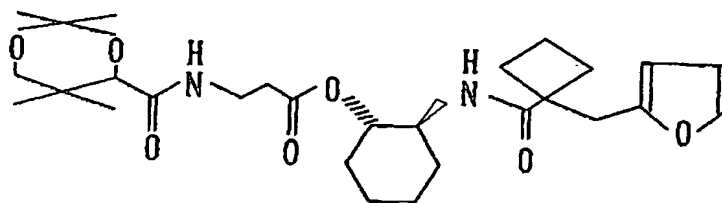
NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):0.84-1.55 (4H, m), 0.95 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.58-2.67 (12H, m),  
3.00 (1H, d, J=14Hz), 3.03 (1H, d, J=14Hz),

\* 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.27-3.52 (2H, m), 3.68  
(1H, d, J=12Hz), 3.72-3.87 (1H, m), 4.06 (1H,  
s), 4.59 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 4.51  
1H, d, J=8Hz), 6.88 (1H, t, J=5Hz), 7.11-  
7.28 (5H, m)

30 実施例133

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (1-フルフリルシクロブタンカルボニル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-  
[N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式:  $C_{28}H_{42}N_2O_7$ 

分子量: 518.65

質量分析 計算値: 518.2992

実測値: 518.2969

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]_{D}^{30}$ ; +12.8° (C=0.5,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{KBr}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3352, 2944, 2868, 1732

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.18-2.57 (16H, m),  
1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s), 3.03 (2H, s),  
3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.33-3.58 (2H, m),  
3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.67-3.90 (1H, m),  
4.07 (1H, s), 4.63 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz),  
5.49 (1H, d, J=8Hz), 6.03 (1H, d, J=3Hz),  
6.26 (1H, dd, J=3Hz, 1Hz), 6.92 (1H, t, J=5Hz),

50

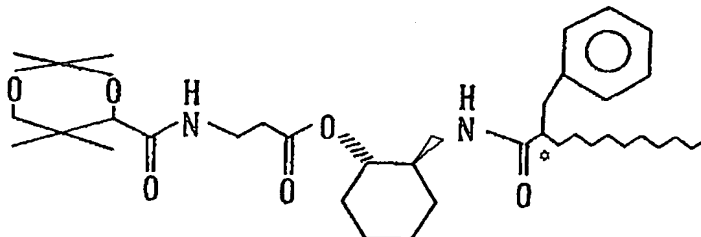
(121)

241

7.29 (1H, d, J=1Hz)

実施例134

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-ベンジルラウロイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - [N - (2, \*

分子式: C<sub>37</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 628.90

質量分析 計算値: 628.4451

実測値: 628.4442

融点 (°C): wax

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>20</sup>; -5.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2860, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.62-1.50 (20H, m), 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.95

(3H, s), 1.03 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.46

(3H, s), 1.52-2.30 (7H, m), 2.38-2.55 (2H, m), ※

242

\* 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

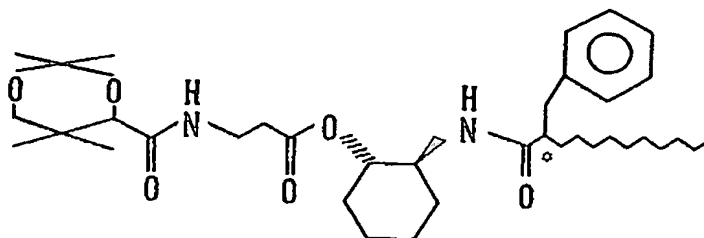
構造式:

※ 2.68 (1H, dd, J=15Hz, 6Hz), 2.83 (1H, dd, J=15Hz, 10Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.48 (2H, dt, J=6Hz, 6Hz), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 3.70-3.83 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.50 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 5Hz), 5.91 (1H, d, J=8Hz), 6.88 (1H, t, J=6Hz), 7.11-7.27 (5H, m)

実施例135

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (1-ベンジルラウロイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>37</sub>H<sub>60</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 628.90

質量分析 計算値: 628.4451

実測値: 628.4478

融点 (°C): wax

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>27</sup>; +26.7° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>KBr</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3300, 2932, 2860, 1734

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.95 (3H, s), 1.03 (3H, s), 40

1.06-1.50 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),

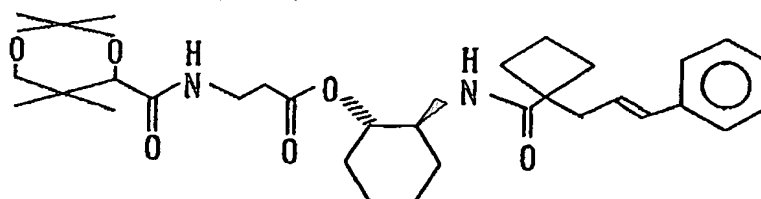
1.52-2.30 (9H, m), 2.61 (1H, dd, J=15Hz, 6Hz), ☆

☆ 2.93 (1H, dd, J=15Hz, 10Hz), 3.20-3.30 (2H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.71-3.83 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.55 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.91 (1H, d, J=7Hz), 6.81 (1H, t, J=5Hz), 7.13-7.28 (5H, m)

実施例136

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (1-シンナミルシクロブタンカルボニル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>32</sub>H<sub>46</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 554.73

質量分析 計算値: 554.3355

実測値: 554.3361

(122)

243

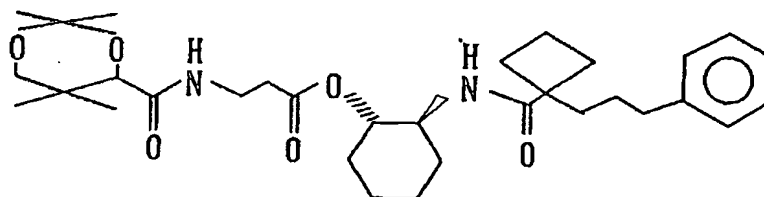
融点 (°C) : カラメル

旋光度  $[\alpha]^{29D}$  ; +14.9° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu_{\text{KBr}}$ , cm<sup>-1</sup>) :

3340, 2944, 2868, 1732

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) :

0.89-1.57 (4H, m), 0.95 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
 1.41 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.58-2.67 (12H, m),  
 2.59 (2H, d, J=7Hz), 3.27 (1H, d, J=12Hz),  
 3.32-3.63 (2H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 3.82  
 - 3.95 (1H, m), 4.06 (1H, s), 4.68 (1H, ddd, J=

分子式 : C<sub>32</sub>H<sub>48</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 556.74

質量分析 計算値: 556.3512

実測値: 556.3516

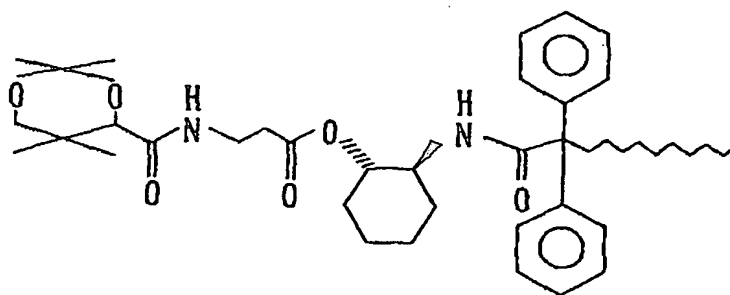
融点 (°C) : カラメル

旋光度  $[\alpha]^{29D}$  ; +12.5° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu_{\text{KBr}}$ , cm<sup>-1</sup>) :

3352, 2940, 2868, 1732

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) :

0.95 (3H, s), 0.95-1.56 (6H, m), 1.03 (3H, s),  
 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 1.62-2.48 (14H, m),

分子式 : C<sub>42</sub>H<sub>62</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 690.97

質量分析 計算値: 690.4607

実測値: 690.4604

融点 (°C) : oil

旋光度  $[\alpha]^{29D}$  ; +18.8° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR ( $\nu_{\text{neat}}$ , cm<sup>-1</sup>) :

2932, 2860, 1730

NMR ( $\delta$ , CDCl<sub>3</sub>) :

0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.94 (3H, s), 1.00-1.49  
 (20H, m), 1.04 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.47  
 (3H, s), 1.52-2.38 (8H, m), 3.16-3.28 (1H, m),

244

\* 11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.68 (1H, d, J=8Hz), 6.08  
 (1H, dt, J=16Hz, 7Hz), 6.44 (1H, d, J=16Hz),  
 6.88 (1H, t, J=5Hz), 7.17-7.38 (5H, m)

実施例137

化合物名 : (1S, 2S) - 2 - [ 1 - ( 3 - フェニルプロ  
 ピル) シクロブタンカルボニル) アミノシクロヘキサン  
 - 1 - イル 3 - [ N - ( 2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 -  
 ジオキサン - 4 - カルボニル) アミノ ] プロピオネー  
 ト

\* 10 構造式 :

※ 2.51-2.66 (2H, m), 3.27 (1H, d, J=12Hz), 3.28  
 - 3.48 (2H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 3.79-  
 3.92 (1H, m), 4.06 (1H, s), 4.67 (1H, ddd, J=  
 20 11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.64 (1H, d, J=8Hz), 6.86  
 (1H, t, J=5Hz), 7.12-7.30 (5H, m)

実施例138

化合物名 : (1S, 2S) - 2 - ( 2, 2 - ジフェニルラウロ  
 イル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [ N - ( 2,  
 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カルボ  
 ニル) アミノ ] プロピオネート

※ 構造式 :

3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.36-3.48 (1H, m), 3.68  
 (1H, d, J=12Hz), 3.82-3.94 (1H, m), 4.07 (1H,  
 s), 4.49 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.52  
 40 (1H, d, J=8Hz), 6.82 (1H, t, J=5Hz), 7.18  
 - 7.37 (10H, m)

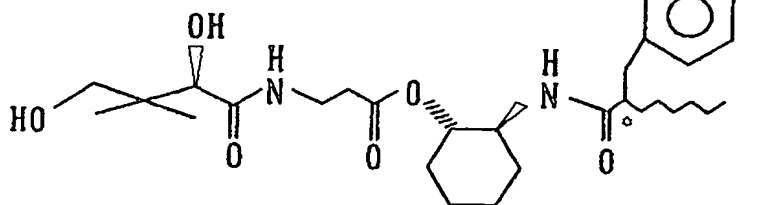
実施例139

化合物名 : (1S, 2S) - 2 - ( 2 - ベンジルカプリロ  
 イル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [ N - ( 2,  
 4 - ジヒドロキシ - 3, 3 - ジメチル - 1 - オキソブチル)  
 アミノ ] プロピオネート

構造式 :

(123)

245



246

分子式:  $C_{30}H_{48}N_2O_6$ 

分子量: 532.72

質量分析 計算値: 532.3512

実測値: 532.3524

融点 (°C): カラメル

旋光度  $[\alpha]^{29D}$ : +28.8° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

2936, 2864, 1728

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.86 (3H, t, J=7Hz), 0.94 (3H, s), 1.02 (3H, s),

1.06-1.50 (12H, m), 1.52-2.35 (9H, m), 2.64

(1H, dd, J=14Hz, 6Hz), 2.89 (1H, dd, J=14Hz, 8H) \*

\* z),

3.22-3.48 (2H, m), 3.48 (1H, d, J=11Hz), 3.51

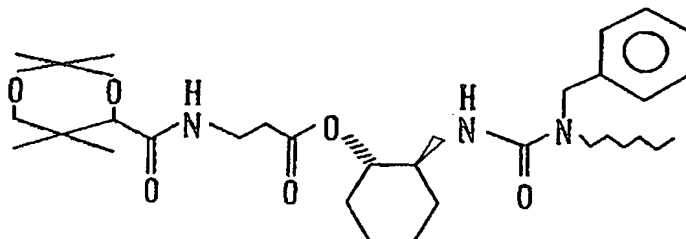
10 (1H, d, J=11Hz), 3.72-3.87 (1H, m), 4.03 (1H, s), 4.54 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.88

(1H, br-s), 7.12-7.29 (6H, m)

実施例140

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (N-ベンジル-N-ヘキシルカルバモイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - [N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式:  $C_{32}H_{51}N_3O_6$ 

分子量: 573.78

質量分析 計算値: 573.3777

実測値: 573.3752

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{28D}$ : +33.2° (C=0.8,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3384, 2936, 2864, 1732

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 0.97-2.18

(16H, m), 1.03 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.46

(3H, s), 2.32-2.53 (2H, m), 3.18 (2H, t, J=7Hz) ※

※ 3.26-3.39 (1H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.43

- 3.56 (1H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.72-

3.85 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.36 (1H, d, J=17Hz),

30 4.46 (1H, d, J=17Hz), 4.50 (1H, d, J=6Hz),

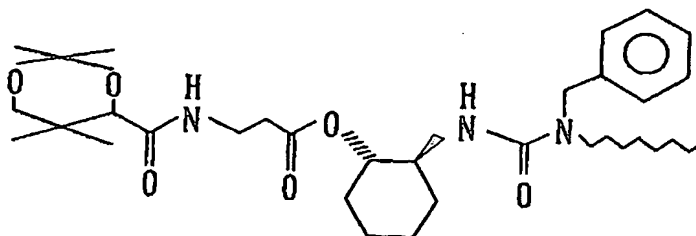
4.62 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 6.88 (1H, t,

J=5Hz), 7.19-7.37 (5H, m)

実施例141

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (N-ベンジル-N-オクチルカルバモイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - [N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式:  $C_{34}H_{55}N_3O_6$ 

分子量: 601.83

質量分析 計算値: 601.4090

実測値: 601.4113

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{28D}$ : +29.7° (C=0.5,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3368, 2932, 2864, 1732

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

50 0.87 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 0.97-2.18

(124)

247

(20H, m), 1.03 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 2.33-2.53 (2H, m), 3.18 (2H, t, J=7Hz), 3.26-3.39 (1H, m), 3.28 (1H, m), 3.43-3.56 (1H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.72-3.85 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.37 (1H, d, J=17Hz), 4.48 (1H, d, J=17Hz), 4.49 (1H, d, J=6Hz), 4.62 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 6.88 (1H, t, J=5Hz),

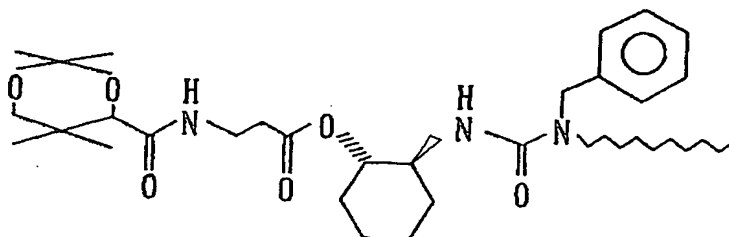
248

\* 7.19-7.36 (5H, m)

実施例142

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (N-ベンジル-N-デシルカルバモイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - (N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ) プロピオネート

\* 構造式:

分子式: C<sub>36</sub>H<sub>59</sub>N<sub>3</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 629.88

質量分析 計算値: 629.4403

実測値: 629.4388

融点 (°C): oil

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>27</sup>; +26.1° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3384, 2932, 2860, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.96 (3H, s), 0.79-2.19

(24H, m), 1.03 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.46

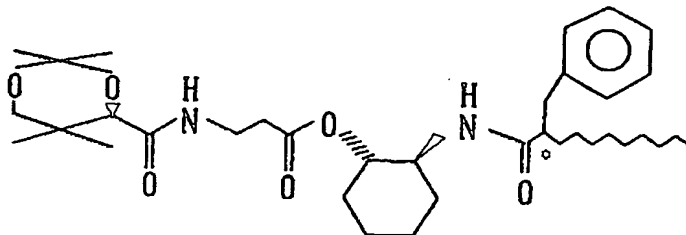
(3H, s), 2.32-2.53 (2H, m), 2.18 (2H, t, J=7Hz), ※

※ 3.23-3.38 (1H, m), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.32-3.55 (1H, m), 3.69 (1H, d, J=12Hz), 3.70-3.85 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.36 (1H, d, J=17Hz), 4.47 (1H, d, J=17Hz), 4.48 (1H, d, J=6Hz), 4.61 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 6.89 (1H, t, J=5Hz), 7.20-7.39 (5H, m)

実施例143

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-ベンジルウンデカノイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - (N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ) プロピオネート

構造式:

分子式: C<sub>36</sub>H<sub>58</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>

分子量: 614.87

質量分析 計算値: 614.4294

実測値: 614.4295

融点 (°C): wax

旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>28</sup>; -7.7° (C=1.0, CHCl<sub>3</sub>)IR (ν<sub>neat</sub>, cm<sup>-1</sup>):

3320, 2932, 2860, 1732

NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>):

0.62-1.49 (18H, m), 0.88 (3H, t, J=7Hz), 0.95

(3H, s), 1.03 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.46

(3H, s), 1.51-1.95 (6H, m), 2.08-2.19 (1H, m),

2.37-2.56 (2H, m), 2.68 (2H, dd, J=14Hz, 6Hz), 2.83 (1H, dd, J=14Hz, 9Hz), 3.28 (1H, d, J=12Hz), 3.44-3.52 (2H, m), 3.68 (1H, d, J=12Hz), 3.70-3.82 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.51 (1H, ddd, J=11Hz, 11Hz, 4Hz), 5.42 (1H, d, J=8Hz), 6.88 (1H, t, J=5Hz), 7.11-7.30 (5H, m)

40 実施例144

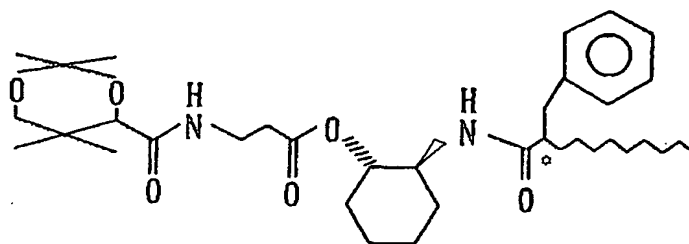
化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-ベンジルウンデカノイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - (N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ) プロピオネート

構造式:

(125)

249

250

分子式:  $C_{36}H_{58}N_2O_6$ 

分子量: 614.87

質量分析 計算値: 614.4294

実測値: 614.4276

融点 (°C): oil

旋光度  $[\alpha]^{27D}$ ; +27.4° (C=1.0,  $CHCl_3$ )IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ):

3304, 2932, 2860, 1734

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

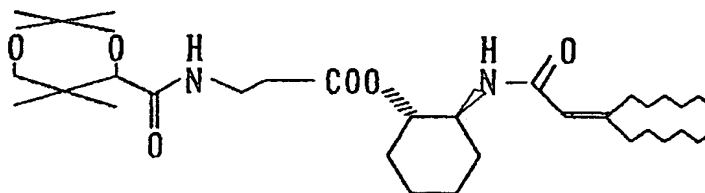
0.88 (3H, t,  $J=7Hz$ ), 0.95 (3H, s), 0.98-1.49  
(18H, m), 1.03 (3H, s), 1.43 (3H, s), 1.44  
(3H, s), 1.52-2.30 (9H, m), 2.61 (1H, dd,

\*  $J=14Hz, 6Hz$ ), 2.94 (1H, dd,  $J=14Hz, 9Hz$ )  
3.22-3.29 (2H, m), 3.28 (1H, d,  $J=12Hz$ ), 3.69  
10 (1H, d,  $J=12Hz$ ), 3.71-3.84 (1H, m), 4.07 (1H,  
s), 4.55 (1H, ddd,  $J=11Hz, 11Hz, 4Hz$ ),  
5.91 (1H, d,  $J=8Hz$ ), 6.81 (1H, t,  $J=5Hz$ ),  
7.12-7.28 (5H, m)

実施例145

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (3-ヘキシル-2-ノネ  
ノイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3- [N-  
(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カル  
ボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

分子式:  $C_{33}H_{58}N_2O_6$ 

分子量: 578.93

IR ( $\nu_{neat}$ ,  $cm^{-1}$ ): 1660, 1736NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

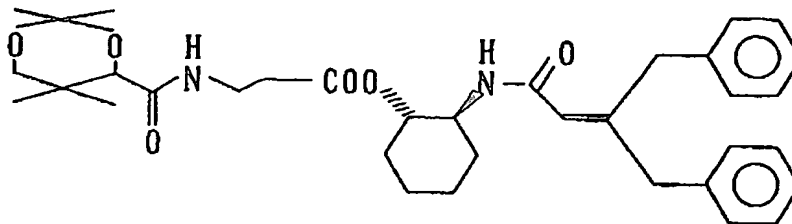
0.87 (3H, t,  $J=7Hz$ ), 0.88 (3H, t,  $J=7Hz$ ), 0.96  
(3H, s), 1.04 (3H, s), 1.10-1.50 (16H, m),  
1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.57-1.88 (6H, m),  
1.88-2.18 (4H, m), 2.43-2.64 (4H, m), 3.28  
(1H, d,  $J=12Hz$ ), 3.49 (1H, td,  $J=6Hz$ ), 3.69

※ (1H, d,  $J=12Hz$ ), 3.84-4.02 (1H, m), 4.08 (1H,  
s), 4.64 (1H, td,  $J=Hz$ ), 5.42 (1H, t),  
5.67 (1H, d,  $J=Hz$ ), 6.92 (1H, m)

実施例146

30 化合物名: (1S, 2S) - 2 - (3-フェニルメチル-4  
-フェニル-2-ブテノイル) アミノシクロヘキサン-  
1-イル 3- [N- (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-  
ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

※ 構造式:

分子式:  $C_{35}H_{46}N_2O_6$ 

分子量: 590.83

融点 (°C): wax

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.93 (3H, s), 1.00 (3H, s), 0.90-2.12 (8H, m),  
1.39 (3H, s), 1.45 (3H, s), 2.24-2.54 (2H, m),  
3.07 (1H, dd,  $J=Hz, 3Hz$ ), 3.26 (1H, d,  $J=12Hz$ ),  
3.20-3.64 (2H, m), 3.53 (2H, dd,  $J=15Hz, 5Hz$ ),  
3.67 (1H, d,  $J=12Hz$ ), 3.80-3.94 (1H, m), 4.04

(1H, s), 4.60 (1H, ddd,  $J=Hz, 10Hz, 4Hz$ ),  
5.76 (1H, d,  $J=8Hz$ ), 6.60 (1H, s), 6.84 (1H, t,  
 $J=Hz$ ), 7.16-7.42 (10H, m)

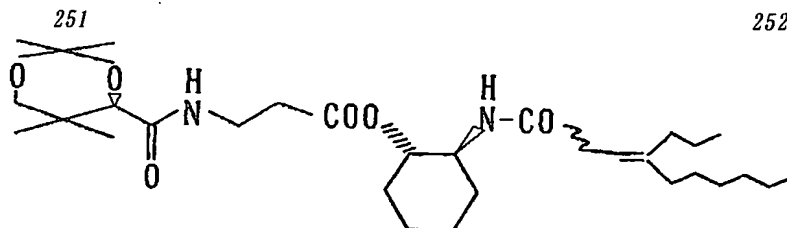
実施例147

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (3-プロピル-2-ノネ  
ノイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3- [N-  
(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カル  
ボニル) アミノ] プロピオネート

50 構造式:



(126)

分子式:  $C_{30}H_{52}N_2O_6$ 

分子量: 536.84

融点 (°C): wax

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

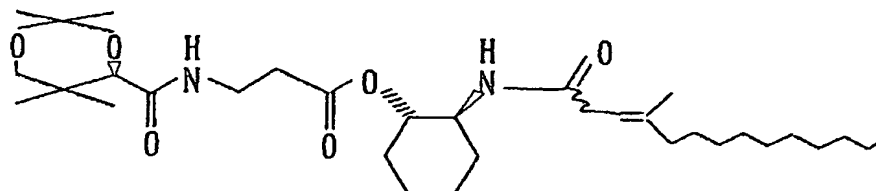
0.80-0.96 (6H, m), 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.06-2.21 (20H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 2.40-2.67 (4H, m), 3.28 (1H, d,  $J=12$ Hz),  
 3.49 (2H, td,  $J=6$ Hz, 6Hz), 3.69 (1H, d,  $J=12$ Hz),  
 3.94 (1H, ddd,  $J=10$ Hz, 8Hz, 4Hz), 4.08 (1H, s),

\* 4.64 (1H, ddd,  $J=10$ Hz, 10Hz, 4Hz), 5.42+5.44  
 (1H, s), 5.67+5.70 (1H, d,  $J=8$ Hz), 6.92 (1H,  
 t,  $J=6$ Hz)

## 10 実施例148

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (3-メチル-2-トリデ  
 セノイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-  
 [N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カ  
 ルボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:



(E, Z-Mixture)

分子式:  $C_{32}H_{56}N_2O_6$ 

分子量: 564.80

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

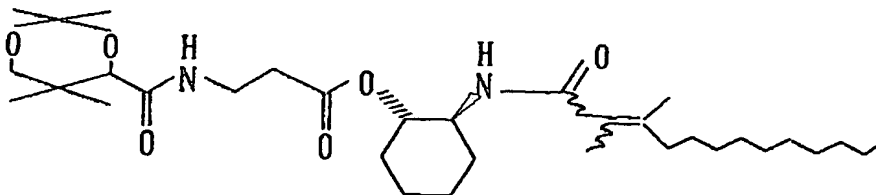
0.88 (3H, t,  $J=6$ Hz), 0.97 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.10-2.21 (26H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 2.12 (3H, s), 2.50 (2H, t,  $J=5$ Hz), 3.28 (1H, d,  
 $J=12$ Hz), 3.41-3.57 (2H, m), 3.69 (1H, d,  $J=$   
 12Hz), 3.86-4.01 (1H, m), 4.09 (1H, s),

※ 4.65 (1H, ddd,  $J=10$ Hz, 10Hz, 4Hz), 5.48 (1H, d,  
 $J=8$ Hz), 6.92 (1H, t,  $J=5$ Hz)

## 実施例149

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2, 3-ジメチル-2-トリ  
 デセノイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3-  
 [N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-  
 カルボニル) アミノ] プロピオネート

※ 構造式:



(E, Z-Mixture)

分子式:  $C_{33}H_{58}N_2O_6$ 

分子量: 578.93

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t,  $J=6$ Hz), 0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
 1.07-2.21 (26H, m), 1.43 (3H, s), 1.46 (3H, s),  
 1.63 (3H, s), 1.75 (3H, s), 2.53 (2H, t,  $J=6$ Hz),  
 3.28 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3. -3.64 (2H, m), 3.69  
 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.88-4.04 (1H, m), 4.08 (1H,

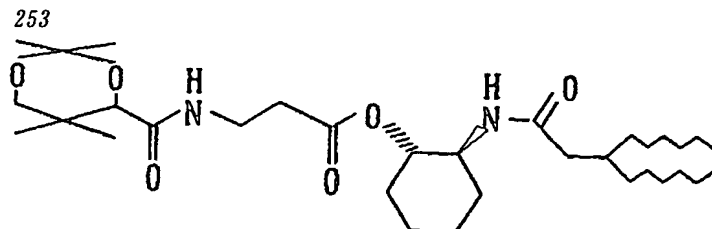
40 s), 4.68 (1H, ddd,  $J=10$ Hz, 10Hz, 4Hz), 5.23+  
 5.58 (1H, d,  $J=9$ Hz), 6.92 (1H, t,  $J=5$ Hz)

## 実施例150

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (3-ヘキシルノナノイ  
 ル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3- [N-(2,  
 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニ  
 ル) アミノ] プロピオネート

構造式:

(127)

分子式:  $C_{33}H_{60}N_2O_6$ 

分子量: 580.95

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

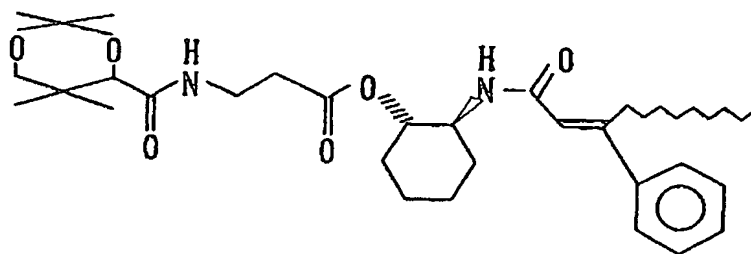
0.87 (6H, t,  $J=6$ Hz), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.10-2.20 (31H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 2.50 (2H, t,  $J=6$ Hz), 3.28 (1H, d,  $J=12$ Hz),  
 3.36-3.60 (2H, m), 3.69 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.88  
 (1H, m), 4.09 (1H, s), 4.64 (1H, ddd,  $J=10$ Hz,

\* 10Hz, 4Hz), 5.88 (1H, d,  $J=8$ Hz), 6.91 (1H, t,  $J=6$ Hz)

実施例151

10 化合物名: (1S, 2S) - 2 - [ (E) - 3 - フェニル -  
 2 - オドデセノイル ] アミノシクロヘキサン - 1 - イル  
 3 - [ N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン  
 - 4 - カルボニル) アミノ ] プロピオネート

\* 構造式:

分子式:  $C_{36}H_{56}N_2O_6$ 

分子量: 612.94

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

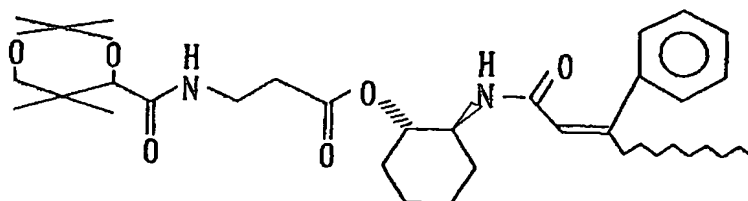
0.55-0.73 (1H, m), 0.97 (3H, t,  $J=6$ Hz), 0.96  
 (3H, s), 1.04 (3H, s), 1.08-2.84 (21H, m),  
 1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.30-2.43 (2H, m),  
 2.48 (2H, t,  $J=6$ Hz), 3.28 (1H, d,  $J=12$ Hz),  
 3.33-3.62 (2H, m), 3.69 (1H, d,  $J=12$ Hz),  
 3.70-3.86 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.28 (1H,

※ ddd,  $J=10$ Hz, 10Hz, 4Hz), 5.06 (1H, d,  $J=9$ Hz),  
 5.85 (1H, s), 6.92 (1H, t,  $J=6$ Hz), 7.12-7.43  
 (5H, m)

実施例152

30 化合物名: (1S, 2S) - 2 - [ (Z) - 3 - フェニル -  
 2 - オドデセノイル ] アミノシクロヘキサン - 1 - イル  
 3 - [ N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン  
 - 4 - カルボニル) アミノ ] プロピオネート

※ 構造式:

分子式:  $C_{36}H_{56}N_2O_6$ 

分子量: 612.94

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.86 (3H, t,  $J=7$ Hz), 0.90 (3H, s), 0.99 (3H, s),  
 1.03-2.28 (22H, m), 1.39 (3H, s), 1.44 (3H, s),  
 2.40-2.6 (2H, m), 2.90-3.20 (2H, m), 3.25  
 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.36-3.63 (2H, m), 3.66 (1H,  
 d,  $J=12$ Hz), 3.91-4.02 (1H, m), 4.06 (1H, s),  
 4.65 (1H, ddd,  $J=10$ Hz, 10Hz, 4Hz), 5.82 (1H, s),

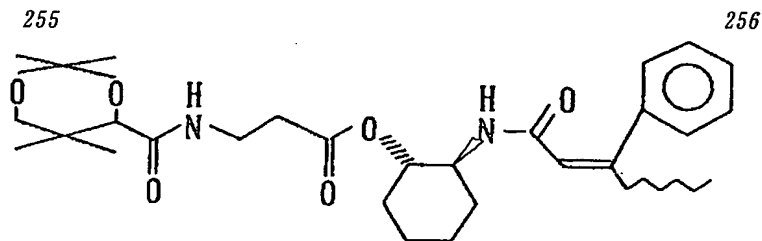
6.04 (1H, d,  $J=8$ Hz), 6.91 (1H, t,  $J=6$ Hz),  
 7.29-7.44 (5H, m)

40 実施例153

化合物名: (1S, 2S) - 2 - [ (Z) - 3 - フェニル -  
 2 - ノネノイル ] アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3  
 - [ N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン  
 - 4 - カルボニル) アミノ ] プロピオネート

構造式:

(128)

分子式:  $C_{33}H_{50}N_2O_6$ 

分子量: 570.85

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

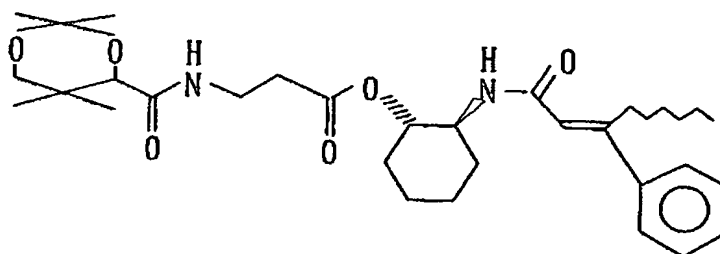
0.83 (3H, t,  $J=7$ Hz), 0.90 (3H, s), 0.99 (3H, s),  
 1.08-2.60 (18H, m), 1.39 (3H, s), 1.44 (3H, s),  
 2.94-3.20 (2H, m), 3.25 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.38  
 - 3.61 (2H, m), 3.66 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.90-  
 4.04 (1H, m), 4.06 (1H, s), 4.65 (1H, ddd,  $J=11$

\* Hz, 11Hz, 4Hz), 5.82 (1H, s), 6.01 (1H, d,  $J=6$ Hz),  
 6.91 (1H, t,  $J=6$ Hz), 7.29-7.44 (5H, m)

## 10 実施例154

化合物名: (1S, 2S) - 2 - [(E) - 3 - フェニル -  
 2 - ノネノイル] アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 -  
 - [N - (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン -  
 4 - カルボニル) アミノ] プロピオネート

\* 構造式:

分子式:  $C_{33}H_{50}N_2O_6$ 

分子量: 570.85

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

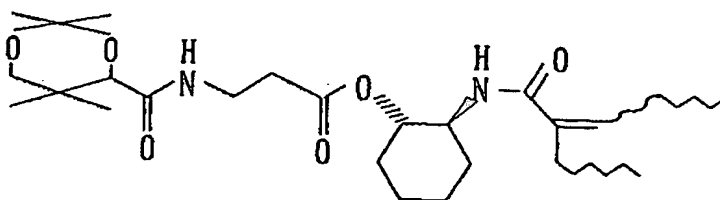
0.55-0.72 (1H, m), 0.85 (3H, t,  $J=7$ Hz), 0.96  
 (3H, s), 1.04 (3H, s), 0.88-1.99 (15H, m),  
 1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.29-2.34 (2H, m),  
 2.48 (2H, t,  $J=6$ Hz), 3.28 (1H, d,  $J=12$ Hz),  
 3.32-3.61 (2H, m), 3.69 (1H, d,  $J=12$ Hz),  
 3.71-3.84 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.28 (1H, ddd,

※  $J=10$ Hz, 10Hz, 4Hz), 5.07 (1H, d,  $J=9$ Hz),  
 5.85 (1H, s), 6.92 (1H, t,  $J=6$ Hz), 7.13-7.45  
 (5H, m)

## 実施例155

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2 - ヘキシリデンオクタ  
 ノイル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N -  
 (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カル  
 ボニル) アミノ] プロピオネート

※ 構造式:

分子式:  $C_{32}H_{56}N_2O_6$ 

分子量: 564.90

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.87 (3H, t,  $J=8$ Hz), 0.88 (3H, t,  $J=8$ Hz), 0.96  
 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.07-2.26 (26H, m),  
 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 2.40-2.66 (2H, m),  
 3.28 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.37-3.64 (2H, m), 3.69  
 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.90-4.06 (1H, m), 4.07 (1H,  
 s), 4.70 (1H, ddd,  $J=10$ Hz, 10Hz, 4Hz), 5.38

(1H, t,  $J=7$ Hz), 5.61 (1H, d,  $J=8$ Hz), 6.91 (1H,  
 t,  $J=6$ Hz)

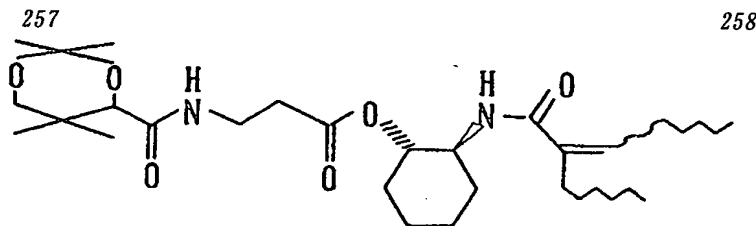
40

## 実施例156

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2 - ヘキシリデンオクタ  
 ノイル) アミノシクロヘキサン - 1 - イル 3 - [N -  
 (2, 2, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3 - ジオキサン - 4 - カル  
 ボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

(129)

分子式:  $C_{32}H_{56}N_2O_6$ 

分子量: 564.90

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

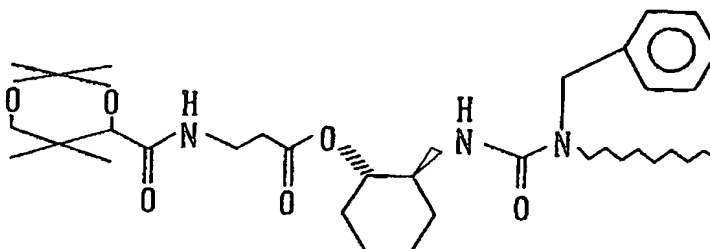
0.88 (3H, t,  $J=7$ Hz), 0.89 (3H, t,  $J=7$ Hz), 0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.06-2.33 (26H, m), 1.42 (3H, s), 1.47 (3H, s), 2.40-2.60 (2H, m), 3.28 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.32-3.62 (2H, m), 3.69 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.86-4.02 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.74 (1H, ddd,  $J=11$ Hz, 11Hz, 4Hz), 5.82

\* (1H, d,  $J=8$ Hz), 6.01 (1H, t,  $J=7$ Hz), 6.90 (1H, t,  $J=6$ Hz)

実施例157

10 化合物名: (1S, 2S) - 2 - (N-ベンジル-N-ノニルカルバモイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - [N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

分子式:  $C_{35}H_{57}N_3O_6$ 

分子量: 615.86

融点 ( $^{\circ}C$ ): oilNMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

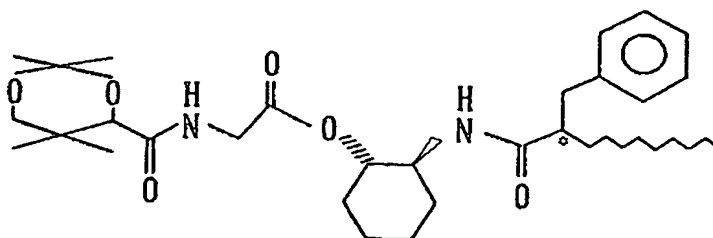
0.88 (3H, t,  $J=7$ Hz), 0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s), 1.05-2.23 (22H, m), 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 2.32-2.53 (2H, m), 3.17 (2H, t,  $J=7$ Hz), 3.25-3.39 (1H, m), 3.28 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.42-3.55 (1H, m), 3.68 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.71-3.83 (1H, m), 4.07 (1H, s), 4.36 (1H, d,  $J=16$ Hz), 4.46

※ (1H, d,  $J=16$ Hz), 4.47 (1H, d,  $J=8$ Hz), 4.62 (1H, ddd,  $J=11$ Hz, 11Hz, 4Hz), 4.87 (1H, t,  $J=6$ Hz), 7.20-7.37 (5H, m)

実施例158

30 化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-ベンジルウンデカノイル) アミノシクロヘキサン-1-イル N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノアセテート

構造式:

分子式:  $C_{35}H_{56}N_2O_6$ 

分子量: 600.84

融点 ( $^{\circ}C$ ): oilNMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.88 (3H, t,  $J=7$ Hz), 1.02 (3H, s), 1.08 (3H, s), 1.12-2.24 (25H, m), 1.46 (3H, s), 1.54 (3H, s), 2.61 (1H, dd,  $J=13$ Hz, 5Hz), 2.92 (1H, dd,  $J=13$ Hz, 9Hz), 3.22 (1H, dd,  $J=18$ Hz, 5Hz), 3.31 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.70-3.84 (1H, m), 3.71 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.94 (1H, dd,  $J=18$ Hz, 7Hz), 4.13

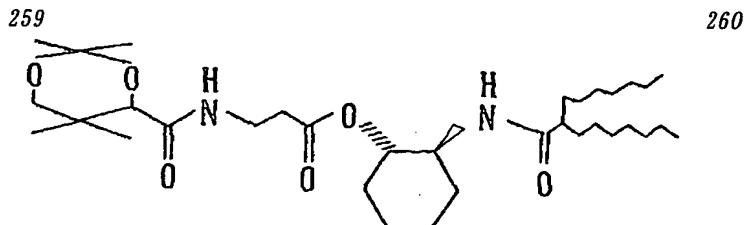
H, s), 4.62 (1H, ddd,  $J=11$ Hz, 11Hz, 4Hz), 5.51 (1H, d,  $J=8$ Hz), 6.64-6.72 (1H, m), 7.14-7.21 (3H, m), 7.23-7.32 (2H, m)

実施例159

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-ヘプチルノナノイル) アミノシクロヘキサン-1-イル 3 - [N-(2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

(130)

分子式:  $C_{34}H_{62}N_2O_6$ 

分子量: 594.88

融点 (°C): wax

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.87 (6H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.96 (3H, s), 1.04 (3H, s),  
 1.08-2.21 (33H, m), 1.43 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 2.41-2.58 (2H, m), 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.51  
 (2H, dt,  $J=6\text{Hz}$ , 6Hz), 3.69 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ),  
 3.82-3.95 (1H, m), 4.08 (1H, s), 4.68 (1H, ddd,

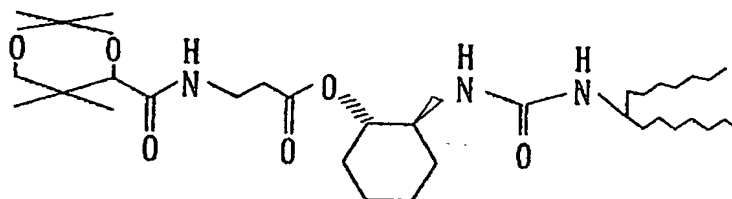
\*  $J=11\text{Hz}$ , 11Hz, 4Hz), 5.80 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.91  
 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ )

実施例160

10 化合物名: (1S, 2S) - 2 - [(1-ヘプチルオクチ  
 ル) カルバモイル] アミノシクロヘキサン-1-イル  
 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン  
 -4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

\*

分子式:  $C_{34}H_{63}N_3O_6$ 

分子量: 609.89

融点 (°C): wax

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.87 (6H, t,  $J=7\text{Hz}$ ), 0.96 (3H, s), 1.03 (3H, s),  
 1.08-2.28 (32H, m), 1.44 (3H, s), 1.47 (3H, s),  
 2.38-2.57 (2H, m), 3.28 (1H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.31  
 - 3.42 (1H, m), 3.54-3.82 (3H, m), 3.69 (1H, d,  
 $J=12\text{Hz}$ ), 4.10 (1H, s), 4.48 (1H, br-s),

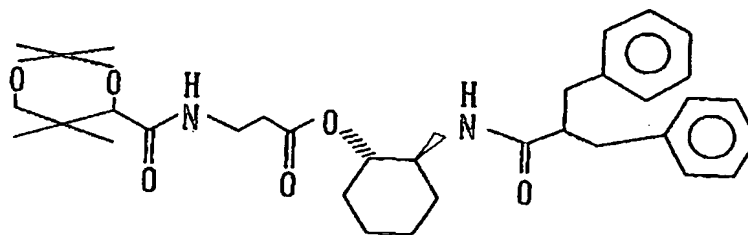
※ 4.55 (1H, ddd,  $J=11\text{Hz}$ , 11Hz, 4Hz), 4.83 (1H,  
 br-s), 6.90 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ )

実施例161

化合物名: (1S, 2S) - 2 - (2-ベンジル-3-フェ  
 ニルプロパノイル) アミノシクロヘキサン-1-イル  
 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル-1, 3-ジオキサン  
 -4-カルボニル) アミノ] プロピオネート

構造式:

※30

分子式:  $C_{34}H_{46}N_2O_6$ 

分子量: 578.75

融点 (°C): カラメル

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.94 (3H, s), 0.95-2.23 (10H, m), 1.03 (3H, s),  
 1.42 (3H, s), 1.46 (3H, s), 2.43-2.56 (1H, m),  
 2.68-3.09 (4H, m), 3.15-3.32 (2H, m), 3.27  
 (2H, d,  $J=12\text{Hz}$ ), 3.59-3.69 (1H, m), 3.68 (1H,  
 d,  $J=12\text{Hz}$ ), 4.06 (1H, s), 4.35 (1H, ddd,

$J=11\text{Hz}$ , 11Hz, 4Hz), 5.38 (1H, d,  $J=8\text{Hz}$ ), 6.77  
 (1H, t,  $J=6\text{Hz}$ ), 7.12-7.28 (10H, m)

40 実施例162

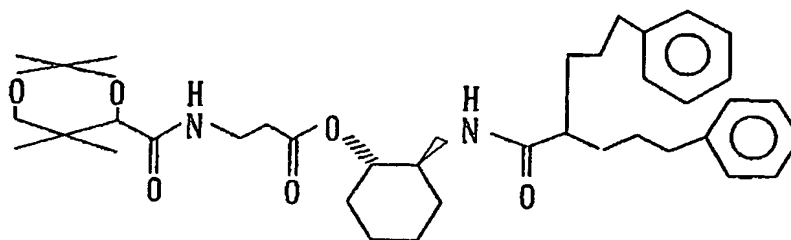
化合物名: (1S, 2S) - 2 - [5-フェニル-2-(3  
 -フェニルプロピル) ペンタノイル] アミノシクロヘキ  
 サン-1-イル 3 - [N - (2, 2, 5, 5-テトラメチル  
 -1, 3-ジオキサン-4-カルボニル) アミノ] プロピ  
 オネート

構造式:

(131)

261

262

分子式:  $C_{38}H_{54}N_2O_6$ 

分子量: 634.86

融点 (°C): カラメル

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

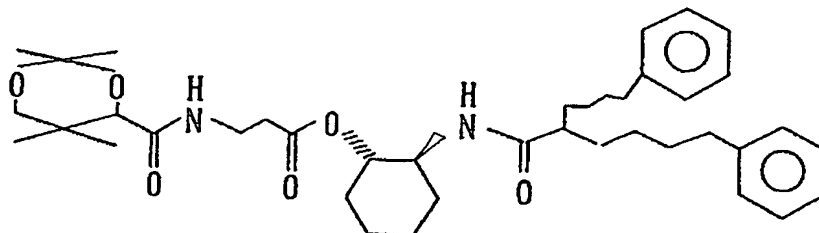
0.93 (3H, s), 0.98-2.27 (19H, m), 1.02 (3H, s),  
1.41 (3H, s), 1.46 (3H, s), 2.48-2.64 (4H, m),  
3.12-3.28 (2H, m), 3.27 (1H, d,  $J=12$ Hz), 3.67  
(1H, d,  $J=12$ Hz), 3.78-3.91 (1H, m), 4.05 (1H,  
s), 4.59 (1H, ddd,  $J=11$ Hz, 11Hz, 4Hz), 5.87

\* (1H, d,  $J=8$ Hz), 6.75 (1H, t,  $J=6$ Hz), 7.11-  
7.30 (10H, m)

## 10 実施例163

化合物名: (1S, 2S) - 2 - [6-フェニル-2-(4-  
フェニルブチル)ヘキサノイル]アミノシクロヘキサ  
ン-1-イル 3-[N-(2,2,5,5-テトラメチル-  
1,3-ジオキサン-4-カルボニル)アミノ]プロピオ  
ネート

\* 構造式:

分子式:  $C_{40}H_{58}N_2O_6$ 

分子量: 662.91

融点 (°C): oil

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

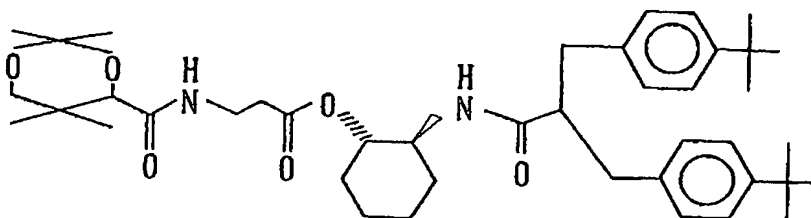
0.84-2.14 (21H, m), 0.94 (3H, s), 1.01 (3H, s),  
1.41 (3H, s), 1.45 (3H, s), 2.32-2.61 (6H, m),  
3.27 (1H, d,  $J=8$ Hz), 3.37-3.53 (2H, m), 3.67  
(1H, d,  $J=8$ Hz), 3.78-3.92 (1H, m), 4.06 (1H,  
s), 4.62 (1H, ddd,  $J=11$ Hz, 11Hz, 4Hz), 5.82

※ (1H, d,  $J=8$ Hz), 6.86 (1H, t,  $J=6$ Hz), 7.11-  
7.29 (10H, m)

## 実施例164

化合物名: (1S, 2S) - 2 - [2-(4-tert-ブチル  
ベンジル) - 3-(4-tert-ブチルフェニル)プロパ  
ノイル]アミノシクロヘキサ-1-イル 3-[N-  
(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-  
カルボニル)アミノ]プロピオネート

※ 構造式:

分子式:  $C_{42}H_{62}N_2O_6$ 

分子量: 690.97

融点 (°C): カラメル

NMR ( $\delta$ ,  $CDCl_3$ ):

0.94 (3H, s), 1.02 (3H, s), 1.05-1.84 (8H, m),  
1.28 (9H, s), 1.29 (9H, s), 1.41 (3H, s),  
1.46 (3H, s), 2.12-2.34 (2H, m), 2.48-2.58

40 (1H, m), 2.66-3.04 (4H, m), 3.27 (1H, d,  $J=$   
12Hz), 3.33 (2H, dt,  $J=6$ Hz, 6Hz), 3.61-3.73  
(1H, m), 3.68 (1H, d,  $J=12$ Hz), 4.06 (1H, s),  
4.38 (1H, ddd,  $J=11$ Hz, 11Hz, 4Hz), 5.32 (1H, t,  
 $J=8$ Hz), 6.83 (1H, t,  $J=6$ Hz), 7.06 (2H, d,  $J=$   
8Hz), 7.11 (2H, d,  $J=8$ Hz), 7.26 (2H, d,  $J=8$ Hz),  
7.28 (2H, d,  $J=8$ Hz)

(132)

フロントページの続き

(51) Int. Cl. 6

C 0 7 C 237/22

327/20

C 0 7 D 319/06

識別記号

庁内整理番号

F I

技術表示箇所

C 0 7 C 237/22

327/20

C 0 7 D 319/06